WO 03/099765 Ai

(19) 世界知的所有權機關 国際事務局

(43) 函際公開日 2003 年12 月4日 (04.12.2003)

PCT

2



(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出館

(10) 国際公開番号 WO 03/099765

(51) 国際特許分類"。 COTC 133/83, 311/46, COTD 209/16, 213/40, 217/06, 207/32, 337/06, 401/12, 405/1 310, 3/14, 9/02, 9/10, 9/14, 11/00, 13/00, 13/02, 13/08, 13/10, 13/12, 17/06, 19/10, 25/00, 25/02, 25/16, 25/28, 27/02, 27/06, 29/00, 35/00, 35/02, 35/04, 37/00, 43/00

(21) 国際出開番号: (22) 国際出租日: PCT/JP03/06678

(30) 歴先権データ: (26) 国際公開の言語: (25) 国際出租の合語 日本間

| 出願人 /米固を除く全ての指定菌について): 小野 裏島工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]: 〒541-8526 大阪府 大阪市 中央区道存 町2丁目1番5号 Osaka (JP).

3

特別2002-153592

(71) 免明者; および (75) 免明者/出題人 /米国についてのみ); 巾下 広 (HABASHITA,Hirome) [JPJP]; 〒618-8585 大阪府三

2002年5月28日(28.05.2002) JP 2003年5月28日(28.05.2003) 日本語 (74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE, Kunihlas): 〒103-0013 東京 想 中央区 日本福人形町 2 丁目 2 巻8 号 短口第 2 ピルフ 啓 大家特許事務所 Tokyo (JP). Pi Osaka (JP)

18 (81) 指定图 (图内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, RG, BR, RY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, BC, EE, ES, F, GB, GD, GG, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MS, MR, MN, MZ, NI, NO, NIZ, OM, PH, PI, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, AZ, AZM, ZW,

(84) 指定図/広場); ARIPO 特許 (JII, GM, KE, LS, MW, MK, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, DY, KG, KZ, MD, RU, TI, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CII, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,

/独翠有/

(54) Title: B-ALANINE DERIVATIVE AND USE THEREOF

(54) 免明の名称: β-アラニン誘導体およびその用途

(57) Abstract: A compound of the general formula: (1) wherein the symbols are as defined in the description, or a prodrug or salt thereof. This polyuria), cancer-associated diseases (solid tumor, solid tumor metastasis, angiofibroma, myeloma, tract), inflammation tract infections (e.g., obstruction of lower urinary symptoms attributed to diabetes, lower urinary spine, disk hemiation, or neuropathic bladder, bone tomors of the and/or treatment of urologic diseases (symptoms aningonism and hence is useful in the prevention compound engages in LPA receptor bonding and multiple mycloma, Kaposi's sarcoma, Icukemii prostate-gland of lower urinary tract and spinal canal stenosis,

(diseases accompanied by abnormal angiogenesis, blocked artery and lung fibrosis), inflammation/immune diseases (psoriasis, nephropathy, hepatisis and pneumonia), diseases caused by secretion disorder (Sjogren's syndrome) or brain-associated diseases (brain block, cerebral hemorrhage and cerebral or peripheral nerve disorder). and wet metastasts of cancer), proliferative diseases

WO 03/099765 A1

GR, HU, IE, IT, LU, MC, NI., PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI ₩I¥ IBF, BI, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, MI, MR, NE, SN, TD, TO). 2 文字コード及び他の略語については、定期免行される 各PCTがゼットの機関に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

及付公開會頭: - 国際調査報告等

(57) 概数:

- 殷共 (1)

Ξ

グ、それらの塩に関する (式中の記号は明細魯記録通り。) で示される化合物、それらのプロドラッ

磁血、脳あるいは末梢神経障虧)の予防および/または治療に有用である。 患(固形腫瘍、固形腫瘍気移、血管線維腫、骨髄腫、多発性骨髄腫、カボジ 分泌障害による疾患(シェーグレン症候群)または脳関連疾患(脳梗器、脳 動脈閉塞症、肺線維症)、炎症・免疫系疾患 肉醴、白血病、癌の浸潤転移)、増殖性疾患 (異常な血管新生を伴なう疾患 推問板へルニア、脊柱管狭窄症、糖尿病に起因する症状、下部尿路症(例え 泌尿器系疾患 (前立腺肥大症または神経因性膀胱疾患に伴う症状、脊髄腫瘍 一般式 (1) で示される化合物は、LPA受容体に結合し拮抗するため 下部尿路の閉塞疾患など)、下部尿路の炎症性疾患、多尿)、癌関連疾 (乾癬、腎症、肝炎、肺炎症)、

#

βーアラニン誘導体およびその用途

技術分野

S

途に関する。 ー 2 受容体)拮抗作用を有するβーアラニン誘導体、その製造方法および用 本発明は、医薬として有用なリゾホスファチジン酸受容体(特に、EDG

さらに詳しく替えば、本発明は

5 (1) 一般式(1)

ン誘導体、それらのプロドラッグまたはそれらの非事性塩 (式中、すべての記号は後記と同じ意味を扱わす。) で示される βーアラニ

- (2) それらの製造方法、および
- (3) それらを有効成分として含有する薬剤に関する。

2

背景技術

因子(Platelet activating factor;PAF)など様々な脂質メディエーターが菌

20 生されることが知られている。

され、情報伝達物質として作用し、細胞内に様々なシグナルを伝えることの れるリソホスファチジン酸(以下、LPAと略記する。) は細胞膜より産生 できる脂質である。その中で、天然に存在するLPAはLーαーLPAであ (式中、R^はアシル基、アルケニル基またはアルキル基を表わす。) で示さ

5 2 のLPA受容体はEDG (Endothelial differentiation gene) ー2、4、7と呼ば 容体にカップリングしたGタンパク質を介して細胞内にシグナルを伝える。 系が連動しており、LPA受容体は多彩なシグナルを伝達することが分かっ られており、同受容体は細胞増殖亢進作用、また逆の増殖抑制作用などの応 Pharmacol 2000 Dec; <u>58(6)</u> : 1188-96)。LPA受容体はLPAと結合し、同受 はLPA1、VZG (Ventricular zone gene) -1とも呼ばれている (Mol れており、スフィンゴシン―1リン酸受容体のEDG―1、3、5、6、8 答に関与するとされる。さらに、Gタンパク質の下流にはMAPーキナーゼ LPA受容体に結合しうるGタンパク質としてはGs、Gi、Gqなどが知 と同様にEDG受容体ファミリーの一部を形成している。なお、EDG-2 作用がLPA受容体を介していることが、徐々に証明されてきている。 3 種 最近3種のLPA受容体サプタイプの存在が明らかになり、これらの生理

は組織により異なると考えられている。 イプによってそれらの局在様式が異なることから、それぞれの受容体の役割 また、LPA受容体サプタイプは生体の広範囲に分布しているが、サプタ

WO 03/099765

WO03/007991 号明細苷には、LPAが膵液の分泌を抑制する旨が記載されて LPAがEDG-2を介して尿道の収縮に関与する旨が記載されており、 774, J. Pharm. Pharmacol. 1982, <u>34</u>, 514)。また、WO02/062389 号明細簪には、 モルモット回腸の収縮現象などが知られている (J. Pharm. Pharmacol. 1991, 43 LPAが恭起する薬理作用として、ラット血圧の上昇、ラット結腸および

来上皮癌細胞の増殖(J Cellular Physiol. 1998 174, 261)、卵巣癌細胞の増殖を 亢造させることなどが知られている(J. Urol. 2000, <u>163</u>, 1027)。 その他、LPAと癌との関連性については、これまでにLPAが前立腺由

200

- 5 イト細胞 (Biochem. Biophys. Res. Commun., 1998, <u>248</u>, 436) 、血管平滑筋細胞 7119) 、メサンギウム細胞(Clin. Science 1999, <u>26</u>, 431)、肝細胞、肝ステレ Mol. Physiol., 2002, 282(1): L91) 、 線維芽細胞 (Mol. Cell Biol., 1998, 18(12): (Am. J. Physiol., 1994, <u>267(Cell Physiol.36)</u>; C204)、血管内皮細胞(Am. J. また、癌細胞以外にもLPAが気道平滑筋細胞(Am. J. Physiol. Lung Cell
- 2 Natl. Acad. Sci. USA, 1999, <u>96</u>, 5233)、脂肪細胞 (J. Clin. Invest., 1998, <u>101</u>, 1431) Physiol. Cell Physiol., 2000, <u>278</u>(3) : C612)、グリア結胞/シュワン結胞(Proc は癌細胞始めとして、炎症細胞の細胞遊走にLPAが関与することが知られ など様々な細胞増殖に関与することが知られている。また、細胞増殖以外に ている(Biochem Biophys Res Commun., 1993, 15;193(2), 497)。その他にはL
- 20 知られている。さらにはLPA受容体の一つであるEDG-2のノックアウ 2049) 、血小板凝集作用 (Biochem. Biophys. Res. Commun., 1981, 22, 391) が PAの免疫細胞の増殖・サイトカイン放出制御作用(J. Imuunol. 1999, 162. トマウスの解析から、EDG-2は脳の機能と関連することが分っている (Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 2000, 27, 13384) .
- 25 これらのことから、LPA受容体に拮抗する薬剤は、種々の疾患、すなわ 泌尿器系疾患、癌関連疾患、增殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害

考えられる。 による疾患または脳関連疾患などの予防および/または治療に有用であると

伴う症状(排尿困難(排尿開始運延、排尿時間延長、尿線細小、間欠排尿 泌尿器系疾患としては、例えば、前立腺肥大症または神経因性膀胱疾患に

- 瘍、椎間板ヘルニア、脊柱管狭窄症、糖尿病などに起因する症状(排尿困頻 二段排尿など)、頻尿、夜間頻尿、排尿痛など)、脳血管障害、パーキンン ン病、脳順病、多発性硬化症、シャイードワーガー(Shy-Drager)症、脊髄腫 (排屎開始遅延、排尿時間延長、尿線細小、間欠排尿、二段排尿など)、 顔 夜間頻尿、排尿痛など)、下部尿路症(例えば、下部尿路の閉塞疾患な
- には、乳癌、肺癌、胃癌、食道癌、結腸直腸癌、肝臓癌、卵巣癌、卵胞膜粉 髄腫、多発性骨髄腫、カポジ肉腫、白血病などが挙げられる。 固形腫瘍の中 <u> 胞腫、男性胚腫、頚部癌、子宮内膜癌、前立腺癌、腎躁癌、皮膚癌、</u>骨肉腫 癌関連疾患としては、例えば、固形腫瘍、固形腫瘍転移、血管線維腫、骨

5

と)、下部尿路の炎症性疾患(感染など)、多尿などが考えられる。

5 膵臓癌、尿路癌、甲状腺癌、脳腫瘍などが挙げられる。また、癌の浸潤転移 もLPA受容体拮抗剤によって抑制されると考えられる

症)、動脈閉塞症、肺線維症などが挙げられる。 形成(パセドウ病を含む)、肺炎症、ネフローゼ症候群、および骨組しょう 狭窄、糖尿病性網膜症、血管新生性緑内障、後水晶体繊維增殖症、甲状腺過 増殖性疾患としては、例えば、異常な血管新生を伴なう疾患(例えば、再

20

ン (Sjogren) 症候群などが挙げられる。 が挙げられ、自律神経系異常による分泌障害としては、例えば、シェーグレ ど)、その他の炎症・免疫異常による腎炎、肝炎、肺炎症などが挙げられる。 分泌障害による疾患としては、例えば、自律神経系異常による分泌障害等 炎症・免疫性疾患としては、例えば、乾癬、腎症(例えば、 I g A 腎症な

脳関連疾患としては、例えば、脳梗塞、脳溢血、脳あるいは末梢神経障害

PCT/JP03/06678

などが挙げられる。

WO01/60819 号明細御には、一般式(B)

[式中、R18は、歴換甚を有してもよい、アルキル基、アリール基、複媒原式甚、アルキルオキシ甚、アリールオキシ基、アルキルチオ甚、アリールチオ法、またはハロゲン原子を表わし、

Kaaは、歴換基を有してもよい、アルキル基、アリール基、複葉環式基、アルキルオキシ基、アリールオキシ基、またはハロゲン基を扱わし、

Rapは、水森原子、低級アルキル基あるいはハロゲン化アルキル基を扱わし、 Rapは、(a)置換基を有してもよい、フェニル基、アリール基、あるいは複媒 原式基、(b)置換あるいは無置換のアルキル基、および(c)置換あるいは無置換 のアルケニル基からなる排から選択される基を表わし、

5

X®は酸素原子あるいは硫黄原子を表わす。但し、R³®とR⁴®は、それらが結合している炭素原子と一緒になって5~10員環構造を形成してもよく、また、R³®が未素原子である場合、R⁴®はメテル基を除く基を表わす。] で示される化合物またはその塩が、LPA受容体拮抗作用を有することが記

5

発明の開示

使されている。

20 本発明者らは、LPA受容体に拮抗作用を示す化合物を見出すべく、鋭意 研究した結果、一般式(I)で示されるβ-アラニン誘導体が目的を違成す ることを見出し、本発明を完成した。

本発明は、LPA受容体に拮抗作用を示すことにより、種々の疾患治療薬となり得る。例えば、血圧に影響しない泌尿器系疾患等の予防および/または治療剤となる可能性がある新規な化合物を提供するものである。

本発明の一般式 (1) で示されるβ-アラニン誘導体は、これまで知られていない新規な化合物である。

本発明は、

(1) 一般式(I)

(式中、AII.

10 (1)C1~6アルキレン基、(2)C2~6アルケニレン基、または(3)C2~6アルキニレン基を扱わし(ただし、Aは1~3回のC1~4アルキル基によって置換されてもよい。)、

 (Cyc1)
 は、(I)C3~15の炭素環、または(2)1~4個の窒素原子、1~

2個の酸素原子および/または1~2個の硫質原子を含む3~15員の複葉原を扱わし、

R1H,

ᅜ

(1)C1~4アルキル基、(2)ハロゲン原子、(3)シアノ甚、(4)トリハロメチル甚、(5)一OR⁶基、(6)ーSR⁷甚、(7)ーNR⁶R⁶甚、(8)ニトロ基、(9)ーCOOR¹⁰

PCT/JP43/06678

甚、(13)−NR¹⁷SO₂R¹ª甚、(14)−S(O)R¹º基、または(15)−SO₂R²º 莊、(10)−CONR''R'9莊、(11)−NR''9COR'4莊、(12)−SO2NR''9R''

- R¹⁹およびR²⁰は、それぞれ独立して、
- (I)水衆原子、または(2)C1~4アルキル基を要わし R²およびR³は、それぞれ独立して、
- (1)C1~4アルキル甚、(2)C1~4アルコキシ基、または(3)ハロゲン原子を
- 5 (I)水霖原子、(2)C 1~4アルキル甚、(3)C 2~4アルケニル甚、(4)C 2~4 R'およびR"は、それぞれ強女して NR²²R²³基によって置換されたC1~4アルキル基、または アルキニル甚、(5)-OR²¹基によって置換されたC1~4アルキル基、(6)-



7 R'とR"はそれらが結合する盗索原子と一緒になって、3~15員の単環、二 含有し、一OR²¹¹基によって置換されたC1~4アルキル基によって置換され 環式または三環式複索環(ただし、該複索環は少なくとも一つの窒素原子を てもよい。) を要わし、

R²¹、R²²、R²³およびR²³は、それぞれ独立して、

20 (1)水穀原子、(2)C 1~4アルキル基、(3)C 2~6アシル基、または(4)トリハ ロアセチル甚を扱わし、

C2~6アルキニレン甚を疲わし(ただし、Eは(I)C1~4アルキル基およ (1) 単結合、(2) C 1 ~ 6 アルキレン基、(3) C 2 ~ 6 アルケニレン基、または(4)

> Rªは、(1)水桒原子、(2)C1~4アルキル基、(3)C2~6アシル基、または キル基によって置換されてもよい。)、 び(2)-ORスーから選択される1~3個の基によって罹壊されたC1~4アル

Cyc2 | は、(I)C3~15の炭素環、または(2)1~4個の瓷業原子、1~

(4)トリハロアセチル基を扱わし、

環を表わし、 2個の酸素原子および/または1~2個の硫黄原子を含む3~15員の複素

(1)C 1~4アルキル甚、(2)ハロゲン原子、(3)シアノ甚、(4)トリハロメチル甚、

5 (5)-OR²⁷甚、(6)-SR²⁸甚、(7)-NR²⁹R²⁰甚、(8)=トロ甚、(9)-COOR 31萬、(10)-CONR32R35萬、(11)-NR34COR35萬、(12)-SO2NR36R3 7萬、(13)—NR38SO2R39萬、(14)—S (0) R40萬、または(15)—SO2R41

R27, R44, R29, R50, R31, R32, R33, R34, R35, R36, R37, R33, R39,

2 R®およびR*Iは、それぞれ独立して、

(1)水森原子、または(2)C1~4アルキル基を扱わし、

mは、0または1~4の盤数を表わし、 iは、0または1~5の整数を表わし、

pは、0または1~5の整数を扱わす。 0または1~4の整数を扱わし、

20

mが2以上を表わすとき、複数のR²は各々同じでも異なってもよく、nが2 表わすとき、複数のR²⁴は各々同じでも異なってもよい。] 以上を扱わすとき、複数のR®は各々同じでも異なってもよく、pが2以上を ただし、iが2以上を扱わすとき、複数のR1は各々同じでも異なってもよく、

25 で示されるβーアラニン勝導体、それらのプロドラッグまたはそれらの非霉

在抽

(2) 一般式 (IA)

$$\begin{array}{c} R^{42}O \\ Cyc1 \\ R^{3} \end{array}$$

$$\begin{array}{c} R^{4} \\ R^{3} \end{array}$$

$$(1A)$$

(式中、K4は、(1)C1~8アルキル基、または(2)1~2個の水酸基またはアミノ基によって配換されたC1~8アルキル基を表わし、その他の記号は前記(1)の記載と同じ意味を表わす。)で示される前記(1)記載のプロジェース

(3) 一般式 (四)

10 (式中、R⁴³およびR⁴⁴は、それぞれ独立して、(1)水索原子、(2)C1~8アルキル基、または(3)1~2個の水酸基またはアミノ基によって置換されたC1~8アルキル基を扱わし、その他の配号は前配(1)の配彙と同じ意味を扱わす。)で示される前配(1)配載のプロドラッグ、

(4) 一般式 (IC)

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

$$(C)$$

$$(R^{1})_{M}$$

$$(R^{3})_{M}$$

$$(R^{3})_{M}$$

$$(C)$$

(式中、すべての記号は前記(1)の記載と同じ意味を扱わす。)で示される前記(1)記載のプロドラッグ、

(5) 前記(1) 記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩を

5 含有する医薬組成物、

(6) LPA受容体拮抗剤である前記 (5) 記彙の医薬組成物、

(7)LPA受容体がEDG-2受容体である前記 (6) 記憶の医薬組成物、

(8) 泌尿器系疾患の予防および/または治療剤である前配(7) 記娘の医

10 (9) 密関連疾患、均斌性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、 脳関連疾患の予防および/または治療剤である前記(7)記載の医薬組成物、 (10) 前記(1) 記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩 の有効量を哺乳動物に投与することを特徴とする哺乳動物におけるEDGー 2に起因する疾患の予防および/または治療力法、

(11)EDG-2に起因する疾患が、泌尿器系疾患である前配(10)記 歳の予防および/または治療方法、

2

(12) EDG-2に起因する疾患が、癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳関連疾患である前記(10)記憶の予防および/または治療方法、

(13)EDG-2に起因する疾患の予防または治療剤を製造するための前

- (14)EDG-2に起因する疾患が、泌尿器系疾患である前記(13)記 はのは田
- (15) EDG-2に超因する疾患が、癌関連疾患、增殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳関連疾患である前記(13)記憶の使用、
- (16)前配(1)配戦の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩を有効成分とするLPA受容体拮抗剤と、他のLPA受容体拮抗剤、α1遮断剤、抗コリン剤、5αーリダクターゼ阻害剤、および/または抗アンドロゲン剤から選ばれる1種または2種以上の剤を組み合わせてなる泌尿器系疾患の予防および/または治療剤、および
- (17)前記(1)記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩の製造方法に関する。

5

洋細な説明

- 15 本明細替中、C1~4アルキル基とは、メチル、エチル、プロビル、プチル基およびそれらの異性体である。
- 本明細瘤中、C1~8アルキル堪とは、メチル、エチパ、プロピル、プチッ、ベンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル堪およびそれらの異性体であ
- 20 本明細語中、C2~4アルケニル描とは、エテニル、プロペニル、プテニル描およびそれらの異性体である。
- 木明細毎中、C2〜4アルキニル嶅とは、エチニル、プロピニル、プチニル括およびそれらの異性体である。
- 本明細磐中、C1~4アルコキシ茲とは、メトキシ、エトキシ、プロポキ

25

シ、ノトキシ基およびそれらの異性体である。

本明結婚中、C1〜6アルキレン描とは、メチレン、エチレン、トリメチ

レン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン甚およびそれらの異性体である。

- 本明御曹中、C2~6アルケニレン基とは、エテニレン、プロペニレン、プテニレン、ベンテニレン、ヘキセニレン抵およびそれらの異性体である。
- 本明細盤中、C2~6アルキニレン基とは、エチニレン、プロピニレン、プチニレン、ペンチニレン、ヘキシニレン基およびそれらの異性体である。本明細盤中、C2~6アシル基とは、エタノイル、プロパノイル、プタノイル、ペンタノイル、ヘキサノイル基およびそれらの異性体である。本明細盤中、ハロゲン原子とはフッ森、塩素、臭素、ヨウ素原子を意味する明細盤中、ハロゲン原子とはフッ森、塩素、臭素、ヨウ素原子を意味する。
- 10 る。 本明細磐中、トリハロメチル甚とは、3個のハロゲン原子で啞娘され
- 本明細容中、トリハロメチル基とは、3個のハロゲン原子で置換されたメチル基を意味し、例えば、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、トリプロモメチル、トリョードメチル基が挙げられる。
- 本明細番中、トリハロアセチル基とは、3個のハロゲン原子で匯換された 15 アセチル基を意味し、例えば、トリフルオロアセチル、トリクロロアセチル、

トリプロモアセチル、トリョードアセチル基が挙げられる。

- 本明細語中で用いるC3~15の炭素環には、C3~15の単環、二環または三環式不飽和炭素環、その一部または全部が飽和されている炭素環、スピロ結合した二環式炭素環および架橋した二環式炭素環が含まれる。例えば、
- 20 シカロプロパン、シカロプタン、シカロペンタン、シカロペキサン、シカロ ヘプタン、シカロオカタン、シカロノナン、シカロデカン、シカロウンデカ ン、シカロドデカン、シカロトリドデカン、シカロテトラデカン、シカロペ ンタデカン、シカロペンテン、シカロペキセン、シカロペプラン、シカロオ カテン、シカロペンタジエン、シカロペキサジエン、シカロペプタジエン、
- 25 シクロオクタジエン、ペンゼン、ペンタレン、パーヒドロペンタレン、アメレン、バーヒドロアメレン、インデン、パーヒドロインデン、インダン、ナ

ヘプタン、ビシクロ[2, 2, 1] ヘプター2ーエン、ビシクロ[3, 1, ナレン、フェナントレン、アントラセン、スピロ〔4.4〕ノナン、スピロ 2. 2] オカタン、ビシクロ[2. 2. 2] オクター2ーエン、アダマンタ セン、sーインダセン、アセナフチレン、アセナフテン、フルオレン、フェ タレン、ヘプタレン、パーヒドロヘプタレン、ピフェニレン、as-インダ ン、ノルアダマンタン母が挙げられる。 1] ヘプタン、ビシクロ [3. 1. 1] ヘプター2ーエン、ビシクロ [2. [4.5] デカン、スピロ[5.5] ウンデカン、ビシクロ[2.2.1] フタレン、ジヒドロナフタレン、テトラヒドロナフタレン、パーヒドロナフ

5 2 ール、イミダゾール、トリアソール、テトラソール、ピラゾール、ピリジン、 子、1~2個の酸素原子および/または1~2個の硫黄原子から遊択される たは1~2個の硫黄原子を含む3~15員の複素環には、1~4個の窒素原 オキサジン、オキサジアジン、オキサゼピン、オキサジアゼピン、チアジア オキサゾール、チアゾール、インチアゾール、フラザン、オキサジアゾール、 ン、オキセピン、チオフェン、チオピラン、チエピン、オキサゾール、イン よびその一部または全部が飽和されている複葉環が含まれる。例えば、 ヘテロ原子を含む、3~15員の単環、二環または三環式不飽和複杂環、お ピラジン、ピリミジン、ピリダジン、アゼピン、ジアゼピン、フラン、ピラ 本明細鸖中で用いる1~4個の窒素原子、1~2個の酸素原子および/ま

ソール、チアジン、チアジアジン、チアゼピン、チアジアゼピン、インドー ァ、ベングチアソール、ベングイミダソール、クロメン、ベングオキセアン、 キノリン、インキノリン、キノリジン、プリン、フタラジン、プテリジン、 **ベンノオキサゼビン、ベンソオキサジアゼピン、ベンンチェピン、ベンンチ** ナフチリジン、キノキサリン、キナンリン、シンノリン、ベングオキサンー ンソチオフェン、インベンソチオフェン、ジチアナフタレン、インダソール、 **グ、インインドーグ、インドリジン、ベングレラン、インベングレラン、ベ**

20

25

25 20 2 5 ン、テトラヒドロピリミジン、パーヒドロピリミジン、ジヒドロピリダジン、 ン、ピラソリジン、ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリジン、ピペリジン、 チアンスレン、フェナントリジン、フェナントロリン、ペリミジン、アジリ ンソフラザン、ベンソチアジアソール、ベンソトリアソール、カルベソール、 アゼピン、ベンソチアジアゼピン、ベンソアゼピン、ベンソジアゼピン、ベ ジアジン、テトラヒドロオキサジアジン、ジヒドロオキサゼピン、テトラヒ キサソール(インオキサソリジン)、ジヒドロチアソール、テトラヒドロチ ピン、パーヒドロチエピン、ジヒドロオキサソール、テトラヒドロオキサン オピラン、テトラヒドロチオピラン、ジヒドロチエピン、テトラヒドロチエ ン、チエタン、ジヒドロチオフェン、テトラヒドロチオフェン、ジヒドロチ ドロオキセピン、テトラヒドロオキセピン、パーヒドロオキセピン、チイラ フラン、テトラヒドロフラン、ジヒドロピラン、テトラヒドロピラン、ジヒ ロジアゼピン、パーヒドロジアゼピン、オキシラン、オキセタン、ジヒドロ ラヒドロアゼピン、パーヒドロアゼピン、ジヒドロジアゼピン、テトラヒド テトラヒドロピリダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロアゼピン、テト ジヒドロピラジン、テトラヒドロピラジン、ピペラジン、ジヒドロピリミジ トリアソリン、トリアソリジン、テトラソリン、テトラソリジン、ピラソリ ジン、アゼチジン、ピロリン、ピロリジン、イミダンリン、イミダンリジン、 ジベンソチオフェン、フェノチアジン、フェノキサジン、フェノキサチイン、 **βーカルボリン、アクリジン、フェナジン、ジベンソフラン、キサンテン、** ジヒドロオキサジアソール、テトラヒドロオキサジアソール(オキサジアソ アソール (イソチアソリジン) 、ジヒドロフラザン、テトラヒドロフラザン、 アソール (チアソリジン) 、ジヒドロインチアソール、テトラヒドロインチ ール (オキサソリジン) 、 ジヒドロインオキサンール、テトラヒドロインオ ドロオキサゼピン、パーヒドロオキサゼピン、ジヒドロオキサジアゼピン、 リジン)、ジヒドロオキサジン、テトラヒドロオキサジン、ジヒドロオキサ

ヒドロチアジアゼピン、モルホリン、チオモルホリン、オキサチアン、イン **チャカアン、** チアジアジン、ジヒドロチアゼピン、テトラヒドロチアゼピン、パーヒドロ ロチアジン、テトラヒドロチアジン、ジヒドロチアジアジン、テトラヒドロ アジアソール、テトラヒドロチアジアソール(チアジアソリジン)、ジヒド テトラヒドロオキサジアゼピン、パーヒドロオキサジアゼピン、ジヒドロチ ドリン、イソインドリン、ジヒドロベンソフラン、パーヒドロベンソフラン、 ジヒドロチアジアゼピン、テトラヒドロチアジアゼピン、パー

サリン、ジヒドロキナソリン、テトラヒドロキナソリン、パーヒドロキナソ ン、ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、パーヒドロキノキ ジヒドロインキノリン、テトラヒドロインキノリン、パーヒドロインキノリ リン、ジヒドロシンノリン、テトラヒドロシンノリン、パーヒドロシンノリ ジヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、パーヒドロナフチリジ ダソール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、パーヒドロキノリン、 ン、ベンノオキサチアン、ジヒドロベンソオキサジン、ジヒドロベンソチア ジヒドロフタラジン、テトラヒドロフタラジン、パーヒドロフタラジン、

5

5

パーヒドロインベンソチオフェン、ジヒドロインダンール、パーヒドロイン

ジヒドロイソベンソフラン、パーヒドロイソベンゾフラン、ジヒドロベンソ

チオフェン、パーヒドロベンノチオフェン、ジヒドロインベンノチオフェン、

ラヒドロカルパソール、パーヒドロカルパソール、ジヒドロアクリジン、テ ソオキサソール、ジヒドロベンソチアソール、パーヒドロベンソチアソール サゼピン、テトラヒドロベンソオキサゼピン、ジヒドロカルバゾール、テト テトラヒドロベンソジアセピン、ベンソジオキセパン、ジヒドロベンソオキ ンソアゼピン、テトラヒドロベンソアゼピン、ジヒドロベンソジアゼピン、 ジン、ピラジノモルホリン、ジェドロベンメギキサノール、パードドロベン トラヒドロアクリジン、パーヒドロアクリジン、ジヒドロジベンゾフラン、 ジヒドロベンソイミダソール、パーヒドロベンソイミダソール、ジヒドロベ

20

25

フェン、ジオキソラン、ジオキサン、ジチオラン、ジチアン、ジオキサイン 辱が挙げられる。 ダン、スンノジオキサン、クロマン、スンノジチオラン、スンノジチアン環 ジベンソチオフェン、パーヒドロジベンソフラン、パーヒドロジベンソチオ ジヒドロジベンソチオフェン、テトラヒドロジベンソフラン、テトラヒドロ

5 全部が飽和されている複素環が含まれる。例えば、ピロール、イミダソール、 $3 \sim 1.5$ 員の単環、二環または三環式不飽和複葉環、およびその一部または の単環、二環式または三環式複葉環には、少なくとも一つの盗器原子を含む、 **インダソーア、プリン、ベンソイミダソーア、ベンソアカアン、ペンソジア** トリアソール、テトラソール、ピラソール、インドール、インインドール、 本明細番中、R*とR*が結合する簠葉原子と一緒になって扱わす3~15頁

20 2 イミダソリジン、トリアソリン、トリアソリジン、テトラソリン、テトラン ザン、ジヒドロオキサジアソール、テトラヒドロオキサジアソール(オキサ ジン、ピペリジン、ジヒドロピラジン、テトラヒドロピラジン、ピペラジン、 ゼピン、ベンントリアソール、カルパソール、βーカルボリン、1, 2, 3, サソリジン)、テトラヒドロチアソール(チアソリジン)、テトラヒドロイ キサソール (オキサソリジン) 、テトラヒドロインオキサソール (インオキ ドロアゼピン、テトラヒドロアゼピン、パーヒドロアゼピン、ジヒドロジア ヒドロピリダジン、テトラヒドロピリダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒ ジヒドロピリミジン、テトラヒドロピリミジン、パーヒドロピリミジン、ジ リジン、ピラソリン、ピラソリジン、ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリ リミジン、アジリジン、アゼチジン、ピロリン、ピロリジン、イミダンリン、 4ーテトラヒドローBーカルボリン、フェノチアジン、フェノキサジン、ベ ソチアソール (イソチアソリジン) 、ジヒドロフラザン、テトラヒドロフラ ゼピン、テトラヒドロジアゼピン、パーヒドロジアゼピン、テトラヒドロオ

25

15

ジアソリジン)、テトラヒドロオキサジン、ジヒドロオキサジアジン、テ

ドロチアジアジン、テトラヒドロチアジアジン、パーヒドロチアゼピン、テ ヒドロチアジアソール(チアジアソリジン)、テトラヒドロチアジン、ジヒ アゼピン、パーヒドロオキサジアゼピン、ジヒドロチアジアゾール、テトラ ラヒドロオキサジアジン、パーヒドロオキサゼビン、テトラヒドロオキサジ

5 S イソキノリン、ジヒドロフタラジン、テトラヒドロフタラジン、パーヒドロ キノリン、ジヒドロインキノリン、テトラヒドロインキノリン、パーヒドロ **ホグネリン、インドリン、インインドリン、ジヒドロインダンーア、パーロ** トラヒドロチアジアゼピン、パーヒドロチアジアゼピン、モルホリン、チオ ドロインダゾール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、パーヒドロ

フタラジン、ジヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、パーヒド ヒドロキナソリン、ジヒドロシンノリン、テトラヒドロシンノリン、パーヒ ヒドロキノキサリン、ジヒドロキナソリン、テトラヒドロキナソリン、パー ロナフチリジン、ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、パー ドロシンノリン、ジヒドロベンメオキサジン、ジヒドロベンメチアジン、ピ

2 スソール、テトラヒドロカルパソール、パーヒドロカルパソール、ジヒドロ ヒドロベンソジアゼビン、テトラヒドロベンソオキサゼピン、ジヒドロカル ゼピン、テトラヒドロベンソアセピン、ジヒドロベンソジアゼピン、テトラ ロベンソイミダソール、パーヒドロベンソイミダソール、ジヒドロベンソア ソール、ジヒドロベンソチアソール、パーヒドロベンソチアソール、ジヒド ラジノホルホリン、ジェドロベンンオキサンール、パードドロベンンオキサ

20

アクリジン、パーヒドロアクリジン環等が挙げられる。

シス、トランス体)、不斉炭素の存在等による與性体(R、S体、α、β体 のものが含まれる。さらに、二重結合、環、縮合環における異性体(E、Z、 例えば、アルキル甚、アルケニル甚、アルキニル甚、アルコキシ甚、アルキ **レン語、アルケニレン基およびアルキニレン基には直鎖のものおよび分枝顔** 本発明においては、特に指示しない限り異性体はこれをすべて包含する。

25

WO 03/099765

PCT/JP0J/06678

衡化合物、回転異性体、これらの任意の割合の混合物、ラセミ混合物は、す べて本発明に含まれる。 d、 1体)、クロマトグラフ分離による極性体(萬極性体、低極性体)、 平 エナンチオマー、ジアステレオマー)、旋光性を有する光学活性体(D、L、

わし、 / は紙面の手前側 (すなわちβー配置) に結合していることを扱わ 記号 本発明においては、仲に断わらない限り、当業者にとって明らかなように / は、αー配置とβー配置の混合物であることを扱わす。 は紙面の向こう側(すなわちαー配置)に結合していることを要

本発明化合物は、公知の方法で非毒性塩に変換される。

5 ム尊) の塩、アンモニウム塩(テトラメチルアンモニウム塩、テトラプチル トリウム、リチウム等)の塩、アルカリ土類金属(カルシウム、ャグネシウ 本発明化合物の非霉性塩としては、例えば、アルカリ金属(カリウム、ナ 非審性塩は薬学的に許容される水溶性のものが好ましい。

7 チルアミン、シクロペンチルアミン、ベンジルアミン、フェネチルアミン、 アンモニウム塩等)、有機アミン(トリエチルアミン、メチルアミン、ジメ

酸塩、硫酸塩、リン酸塩、硝酸塩等)、有機酸塩(酢酸塩、トリフルオロ酢 ミン等)の塩、酸付加物塩(無機酸塩(塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素 ピペリジン、モノエタノールアミン、ジエタノールアミン、トリス(ヒドロ キシメチル) メチルアミン、リジン、アルギニン、NーメチルーDーグルカ

20 **バロン酸塩料)等)が挙げられる。 ルポン酸塩、トグエンスグポン酸塩、イセチオン酸塩、グブクロン酸塩、グ** 酸塩、クエン酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、ペンゼンス 酸塩、乳酸塩、酒石酸塩、シュウ酸塩、ファル酸塩、ケレイン酸塩、安息香

25 カリ(土類)金属塩、アンモニウム塩、有機アミン塩、酸付加物塩の溶媒和 本発明化合物の非毒性塩には、溶媒和物、または上記本発明化合物のアル

VVO 03/099765

PCT/JP03/06678

容媒和物は非毒性かつ水溶性であることが好ましい。適当な溶媒和物としては、例えば水、アルコール系容媒(エタノール等)等の溶媒和物が挙げらい。

本発明のプロドラッグは特に限定されないが、生物学的利用率および生体 膜透過性の改替されるものが好ましい。本発明の一般式(I)で示される化 合物は、カルボキシル甚を有するため、生体内で切断され、カルボキシル基 に変換されるものまたは生体内で酸化され、カルボキシル基に変換されるも

v

生体内で切断され、カルボキシル基に変換されるものとしては、例えば、一般式 (IA) で示されるカルボン酸エステル簡導体、または一般式 (IB) で示されるカルボン酸アミド誘導体が挙げられる。

5

6

生体内で酸化され、カルボキシル基に変換されるものとしては、例えば、一般式 (IC) で示されるアルコール誘導体が挙げられる。

一般式(I)中、Aとして好ましへは、C1~6アルキレン基であり、よ12 り好ましへはメチレン、エチレン、トリメチレン、またはテトラメチレン基

一般式 (1) 中、

Cyc1 として好ましくは、C5~10の炭菜環、または1~4個の窒素

原子、1~2個の酸素原子および/または1~2個の硫黄原子を含む5~10員の複素原であり、より好ましくは、ペンゼン、ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、シクロヘキサン、ピリジン、ピペリジン、キノリン、テトラヒドロキノリン、ピロール、ピロリジン、インドール、インドリン、フラン、ペンソフラン、チオフェン、またはベンソチオフェン環である。一般式(1)中、R¹として好ましくは、C1~4アルキル基、ハロゲン原

20

子、-OR⁹基、-SR⁷基、-NR⁹R⁹基、ニトロ基、-COOR¹⁰基、-CONR¹¹R¹²基、-NR¹³COR¹⁴基、-SO₂NR¹⁶R¹⁶B、または-NR¹⁷SO₂R¹⁸基であり、より好ましくは、メチル基、エチル基、プロビル甚、ブチル基、フッ衆原子、塩糜原子、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、アミノスルホニル基、またはジメチルアミノスルホニル基である。

たはC1~4アルコキシ基である。 一般式(I)中、R⁴およびR⁶として好ましくは、水泵原子、C1~4アルキル基、C2~4アルケニル基、一OR⁸¹基によって置換されたC1~4アルキル基、-NR²²R²³基によって置換されたC1~4アルキル基、または

一般式(I)中、R²およびR³として好ましくは、C1~4アルキル基、ま

Cyc2 であり、より好ましくは、水葉原子、C1~4アルキ

ル甚、アリル甚、ヒドロキシメチル甚、2-ヒドロキシエチル甚、2-(ジメチルアミノ)エチル甚、または

Cyc2 (R-)_p である。

15 一般式(1)中、R'とR'が結合する窒素原子と一緒になって表わす3~1 5 員の単原、二様式または三様式故葉原として好ましくは、アジリジン、ア ゼチジン、ピロリン、ピロリジン、イミダンリン、イミダンリジン、ピラソ リン、ピラソリジン、ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリジン、ピペリジ ン、ジヒドロピラジン、テトラヒドロピラジン、ジヒドロピリ ジン、テトラヒドロピリダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロピリグ デトラヒドロピリダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロアゼピン、 テトラヒドロアゼピン、パーヒドロアゼピン、ジヒドロガアゼピン、テトラ ヒドロジアゼピン、パーヒドロプアゼピン、デトラヒドロオキサソール(オ

キサンリジン)、テトラヒドロインオキサンール(インオキサンリジン)、テトラヒドロチアソール(チアンリジン)、テトラヒドロインチアソール(インチアンリジン)、テトラヒドロオキサジン、パーヒドロオキサゼピン、テトラヒドロチアジン、パーヒドロチアゼピン、モルホリン、チオモルホリン、インドリン、インインドリン、ジヒドロインダンール、パーヒドロインダン

5 インドリン、インインドリン、ジヒドロインダソール、パーヒドロインダグール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、パーヒドロキノリン、ジヒドロインキノリン、テトラヒドロインキノリン、パーヒドロインキノリン、ジヒドロフタラジン、テトラヒドロナフチリジン、パーヒドロナフチリジン、ジヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、パーヒドロナフチリジン、10 ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、パーヒドロキノキサリン、アトラヒドロキノキサリン、パーヒドロキノキサリン

ン、ジヒドロキナゾリン、テトラヒドロキナゾリン、パーヒドロキナゾリン、ジヒドロシンノリン、テトラヒドロシンノリン、パーヒドロシンノリン、ジヒドロベングオキサジン、ジヒドロベングオキサゾール、パーヒドロベングオキサゾール、ジヒドロベングチアゾール、パーヒドロベングオキサゾール、ジヒドロベングイングソール、パーヒドロベング

2

て、ロペンシン・ル、シェドロペングアゼピン、テトラヒドロペングアゼピン、ジヒドロペングアゼピン、テトラヒドロペングアゼピン、テトラヒドロペングジアゼピン、テトラヒドロペングアゼピン、テトラヒドロペングアゼピン、テトラヒドロペン・ル、パーヒドロカルパグール、ジヒドロアクリジン、パーヒドロアクリジン、カルパグール、βーカルボリン、1, 2, 3, 4ーテトラヒドローβーカルボリ

20

ン、フェノチアジン、フェノキサジン環である。

一般式 (I) 中、Eとして好ましくは、C1~6アルキレン基、またはC2~6アルケニレン基であり、より好ましくは、メチレン、エチレン、トリメチレン、またはテトラメチレン基である。

25 一般式(I)中,

WO 03/099765

 $\left(\mathtt{Cyc2}
ight)$ として好ましくは、 $\mathtt{C5}{\sim}1\,\mathtt{0}$ の炭素環、または $\mathtt{1}{\sim}4\,\mathtt{個の窒素}$

原子、1~2個の酸素原子および/または1~2個の硫黄原子を含む5~10人間の複素環であり、より好ましくは、ペンゼン、ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、シクロヘキサン、ピリジン、ピペリジン、キノリケン、テトラヒドロキノリン、ピロール、ピロリジン、インドール、インドリン、フラン、ペンソフラン、チオフェン、またはペンソチオフェン環である。一般式(1)中、R²⁴として好ましくは、C1~4アルキル甚、ハロゲン原子、一OR²³基、一SR²⁶基、一NR²⁶R²⁶基、二トロ甚、一COOR²¹基、一CONR²⁶R²⁶、より好ましくは、メチル基、エチル基、プロビル基、プラル甚、フッ業原子、塩素原子、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、ブロボ

10 *SO₂R**基であり、より好ましくは、メチル基、エチル基、プロビル基、 チル基、フッ衆原子、塩素原子、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、プロキシ基、アミノスルホニル基、またはジメチルアミノスルホニル基である。 iとして好ましくは0または1~3の盤数である。 mとして好ましくは0または1~2の整数である。

15 nとして好ましくは0または $1\sim2$ の監数である。 pとして好ましくは0または $1\sim3$ の監数である。 -般式 (I) で示される化合物のうち、好ましい化合物としては、-般式 $(I-\Lambda-1)$

$$(R^2)_m$$
 $(R^2)_m$
 $(R^2$

WO 03/099765

PC1/JP03/06678

(式中、すべての記号は前記と同じ意味を扱わす。) で示される化合物

一般式 (I-A-2)

(式中、すべての記号は前記と同じ怒味を扱わす。) で示される化合物、

一般式 (I-A-3)

(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物、

一般式(I-A-4)

(I-A-4)

(式中、すべての記号は前記と同じ意味を扱わす。) で示される化合物、

一般式 (I-A-5)

(式中、すべての記号は前記と同じ意味を扱わす。) で示される化合物、

一般式 (I-A-6)

 $(R^2)_m$ $(V_{C})_{N}$ $(R^2)_m$ $(R^2)_m$ (I-A-6)

(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。)で示される化合物、それらのプロドラックまたはそれらの非毒性塩が挙げられる。

本発明の具体的な化合物としては、実施例に記載した化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの非路性塩が挙げられる。

[本発明化合物の製造方法]

S

一般式(1)、一般式(IA)、一般式(IB)、および一般式(IC)で示される本路明化合物は、以下に示す方法または裏施例に示す方法に従って製造することができる。

10 一般式 (1) で示される化合物は、一般式 (11)

(式中、R"はカルポキシル基の保護基を表わし、R'-'、R*-'、R*-'、R*-'、R*-'、およびR*-'は、R'、R*、R*、R*、およびR*と同じ意味を表わすが、R'-'、

R²¹、R²¹、R⁴¹、およびR⁴¹によって要わされる基に含まれる水酸基、アミノ基またはチオール基は保護が必要な場合には保護されているものとする。 その他の配身は前配と同じ意味を扱わす。)で示される化合物をカルボキシル基の保護基の脱保護反応に付し、さらに必要に応じて保護基の脱保護反応に付い、さらに必要に応じて保護基の脱保護反応に付すことにより製造することができる。

カルボキシル基の保護基としては、例えばメチル基、エチル基、アリル基、 tープチル基、トリクロロエチル基、ペンジル (Bn) 基、フェナシル基、 pーメトキシペンジル基、トリチル基、2ークロロトリチル基またはそれら の構造が結合した固相担体等が挙げられる。

- 10 カルボキシル基の保護基の脱保護反応はよく知られており、例えば、
- (2) 酸性条件下における脱保護反応
- (3) 加水索分解による脱保髄反応、
- (4) 金属を用いた脱保護反応、
- 15 (5) 有機金属を用いた脱保護反応等が挙げられる。 これらの方法を具体的に説明すると、
- (1) アルカリ加水分解による脱保態反応は、例えば、有機溶媒(メタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン等)中、アルカリ金属の水酸化物(水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム等)、アルカリ土類金属の水酸化物(水酸化パリウム、水酸化カルシウム等)または炭酸塩(炭酸ナ

20

(2)酸条件下での脱保腹反応は、例えば、有機溶媒(ジクロロメタン、 クロロホルム、ジオキサン、酢酸エチル、アニソール等)中、有機酸(酢酸、

用いて、0~40℃の温度で行なわれる。

トリウム、炭酸カリウム等)あるいはその水溶液もしくはこれらの混合物を

25 トリフルオロ酢酸、メタンスルボン酸、pートシル酸等)、または無機酸(塩酸、硫酸等)もしくはこれらの混合物(臭化水索/酢酸等)中、0~100℃

PC77JP03/06678

の温度で行なわれる。

0℃の温度で行なわれる。 ラジウム県、水酸化パラジウム、酸化白金、ラネーニッケル等)の存在下、 酢酸またはそれらの2以上の混合溶媒等)中、触媒 (パラジウムー炭素、パ セトニトリル特)、アニド系(ジメチルホルムアニド特)、水、酢酸エチル、 **エン母)、ケャン珠(アセトン、メチバエFバケトン母)、ニトリバ珠(ア** アラコーラ珠(メタノーラ、ドタノーラ母)、ベンガン珠(ベンガン、トラ ラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチルエーテル毎)、 常圧または加圧下の水霧雰囲気下または半酸アンモニウム存在下、0~20 (3) 加水素分解による脱保腹反応は、例えば、溶媒(エーテル系(テト

S

液)中、粉末亜鉛の存在下、超音波をかけるかまたは超音波をかけないで、 の級衝波またはそれらの溶液とテトラヒドロフラン等の有機溶媒との組合 0~40℃の温度で行なわれる。 (4) 金鳳を用いた脱保護反応は、例えば、酸性溶媒(酢酸、pH4.2~7.2 5

5

- 20 尊)および/または有槻酘塩(2-エチルヘキサン酸ナトリウム、2-エチ ジオキサン、エタノール等)、水またはそれらの混合溶媒中、トラップ試験 ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、アセトニトリル、 ルヘキサン酸カリウム等)の存在下、ホスフィン采試薬(トリフェニルホス チルアミン、ピロリジン等)、有機酸(酢酸、ギ酸、2-エチルペキサン酸 (5) 金属錯体を用いる脱保膜反応は、例えば、有機溶媒 (ジクロロメタン、 (水媒代トリプチ ラスメ、トリエチ ラシラン、ジメドン、ホラホリン、ジェ
- ロジウム (1) 等)を用いて、0~40℃の温度で行なわれる。 ウム (II) 、酢酸パラジウム (II) 、塩化トリス (トリフェニルホスフィン) スフィンパラジウム (0)、 二強化アス (トリフェニルホスフィン) パラジ フィン特) の存在下または非存在下、 金鳳饋体(テトラキストリフェニルホ

また、上記以外にも、例えば、T. W. Greene, Protective Groups in Organic

25

Synthesis, Wiley, New York, 1999 に記録された方法によって、脱保護反応を行

分けることにより、目的とする本発明化合物が容易に製造することができる。 保護基の脱保護反応は以下の方法によって行なうことができる。 当業者には容易に理解できることではあるが、これらの脱保髄反応を使い

- 5 ル(Ac)基、ピスロイル基、ベンソイル基、ベンジル(Bn)基、pーメ ル (MOM) 基、1-エトキシエチル (EE) 基、メトキシエトキシメチル トキツペンジァ揺、アリハオキシカパポニル(Alloc) 堪、 (TBDMS) 基、tープチルジフェニルシリル (TBDPS) 基、アセチ (TMS) 基、トリエチルシリル (TES) 基、t-ブチルジメチルシリル (MEM) 基、2ーテトラヒドロピラニル (THP) 甚、トリメチルシリル 水酸基の保護基としては、例えば、メチル基、トリチル基、メトキシメチ
- ートリクロロエトキシカルボニル(Troc)基等が挙げられる。 アミノ基の保護甚としては、例えばベンジルオキシカルボニル基、t-ブ
- 15 M) 甚、2 - (トリメチルシリル) エトキシメチル (SEM) 基等が挙げら ンジァ (Bn) 뵮、pーメトキシベンジァ結、ベンジァオキシメチァ (BO オロアセチル基、9-フルオレニルメトキシカルボニル基(Fmoc)、ベ ルー1ー(4ーピフェニル) エトキシカルボニル(B p o c) 基、トリフル トキシカルポニル甚、アリルオキシカルボニル(Alloc) 甚、1-メチ
- メトキシメチル (MOM) 基、2ーテトラヒドロピラニル (THP) 甚、ジ フェニルメチル甚、アセチル (Ac) 甚が挙げられる。 チオール基の保護基としては、例えばベンジル基、メトキシベンジル基、

20

25 Greene, Protective Groups in Organic Synthesis, Wiley, New York, 1999 に記憶さ 容易にかつ選択的に脱離できる基であれば特に限定されない。例えば、T. W. 水酸基、アミノ基またはチオール基の保護基としては、上記した以外にも

PC17/JP413/06678

れたものが用いられる。

水酸菇、アミノ菇またはチオール基の保護基の脱保護反応はよく知られており、例えば、

- (1) アラセン哲朱公露、
- (2) 酸性条件下における脱保腹反応、

S

- (3) 加水森分解による脱保護反応、
- (4) シリア基の既保護反応
- (5) 金属を用いた脱保額反応、
- (6) 有機金属を用いた脱保護反応等が挙げられる。
- これらの方法を具体的に説明すると、

5

(1) アルカリ加水分解による脱保護反応は、例えば、有機溶媒(メタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン等)中、アルカリ金属の水酸化物(水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム等)、アルカリ土類金属の水酸化物(水酸化パリウム、水酸化カルシウム等)または炭酸塩(炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等)あるいはその水溶液もしくはこれらの混合物を用いて、0~40℃の温度で行なわれる。

2

(2) 酸条件下での脱垛體反応は、例えば、有機溶媒(ジクロロメタン、クロロホルム、ジオキサン、酢酸エチル、アニソール等)中、有機酸(酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、pートシル酸等)、または無機酸(塩酸、硫酸等)もしくはこれらの混合物(臭化水菜/酢酸等)中、0~100℃

20

の温度で行なわれる。

(3) 加水素分解による脱保膜反応は、例えば、溶媒(エーテル系(テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチルエーテル等)、アルコール系(メタノール、エタノール等)、ベンゼン系(ベンゼン、トルエン等)、ケトン系(アセトン、メチルエチルケトン等)、ニトリル系(アセトニトリル等)、アミド系(ジメチルホルムアミド等)、水、酢酸エチル、

25

酢酸またはそれらの2以上の混合溶媒等)中、触媒(パラジウムー炭素、パラジウム県、水酸化パラジウム、酸化白金、ラネーニッケル等)の存在下、常圧または加圧下の水薬雰囲気下またはギ酸アンモニウム存在下、0~200℃の温度で行なわれる。

- (4)シリル基の脱保護反応は、例えば、水と混和しうる有機溶媒(テトラヒドロフラン、アセトニトリル等)中、テトラブチルアンモニウムフルオライドを用いて、0~40℃の温度で行なわれる。
- (5) 金属を用いた脱保護反応は、例えば、酸性溶媒(酢酸、pH4.2~7.2 の級衝液またはそれらの溶液とテトラヒドロフラン等の有機溶媒との混合液) 中、粉末亜鉛の存在下、超音液をかけるかまたは超音液をかけないで、

5

0~40℃の温度で行なわれる。

- 15 (木索化トリプテルスズ、トリエテルシラン、ジメドン、モルホリン、ジエテルアミン、ピロリジン等)、有機酸(酢酸、ギ酸、2-エテルヘキサン酸等) および/または有機酸塩 (2-エテルヘキサン酸ナトリウム、2-エテルヘキサン酸カリウム等) の存在下、ホスフィン系試験(トリフェニルホスフィン等)の存在下または非存在下、金瓜錯本(テトラキストリフェニルホウム(II)、酢酸パラジウム(II)、塩化トリス(トリフェニルホスフィン)ウム(II)、酢酸パラジウム(II)、塩化トリス(トリフェニルホスフィン)
- また、上記以外にも、例えば、T. W. Greene, Protective Groups in Organic Synthesis, Wiley, New York, 1999 に記載された方法によって、脱保護反応を行なうことができる。

ロジウム (I) 等) を用いて、0~40℃の温度で行なわれる。

当業者には容易に理解できることではあるが、これらの脱保護反応を使い

分けることにより、目的とする本発明化合物が容易に製造することができる。 一般式(IA)で示される化合物は、一般式(IIA)

(式中、すべての記号は前記と同じ意味を扱わす。)で示される化合物と、一般式(UB)

RII) HO-1-24

(式中、R42-1は、R42-日じ意味を表わすが、R42-によって表わされる基に含まれる水酸基、またはアミノ基は保護が必要な場合には保護されているものとする。その他の記号は前記と同じ意味を表わす。)で示される化合物をエステル化反応に付し、さらに必要に応じて保護基の脱保護反応に付すことにより製造することができる。

5

エステル化反応は公知であり、例えば、

- (1) 酸ハライドを用いる方法、
- (2) 混合酸無水物を用いる方法、
- (3) 縮合剤を用いる力法等が挙げられる。

ᅜ

これらの方法を具体的に説明すると、

(1)酸ハライドを用いる方法は、例えば、カルボン酸を有機溶媒(クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等)中または無溶媒で、酸ハライド化剤(オキザリルクロライド、チオニルクロラ

イド等)と-20℃~遠流温度で反応させ、得られた酸ヘライドを塩基(ビリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノビリジン、ジインプロピルエチルアミン等)の存在下、アルコールと不活性有機溶媒(クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等)中、0~40℃の温度で反応させることにより行なわれる。また、有機溶媒(ジオキサン、テトラヒドロフラン等)中、アルカリ水溶液(重曹水または水酸化ナトリウム溶液等)を用いて、酸ハライドと0~40℃で反応させることにより行なうこともできる。

- (2) 混合酸無水物を用いる方法は、例えば、カルボン酸を有機溶媒(クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等)中または無溶媒で、塩基(ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノビリジン、ジイソプロピルエチルアミン等)の存在下、酸ハライド(ピバロイルクロライド、トシルクロライド、メシルクロライド等)、または酸誘導体(クロロギ酸エチル、クロロギ酸インプチル等)と、0~40℃で反応させ、得られた混合酸無水物を有機溶媒(クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等)中、アルコールと0~40℃で反応させることにより行なわれる。
- (3) 結合剤を用いる方法は、例えば、カルボン酸とアルコールを、有機溶媒(クロロホルム、ジクロロメタン、ジメテルホルムアミド、ジェチルエ20 ーテル、テトラとドロフラン等)中、または無溶媒で、塩基(ビリジン、ト
- リエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノビリジン等)の存在下または非存在下、結合剤(1, 3ージックロヘキシルカルボジイミド(DCC)、1ーエチルー3ー [3ー(ジメチルアミノ)プロピル] カルボジイミド(EDC)、1, 1'ーカルボニルジイミダソール(CD1)、2ークロロ
- 25 ー1-メチルピリジニウムヨウ紫、1-プロピルホスホン酸環状無水物(1-propanephosphonic acid cyclic anhydride、PPA)等)を用い、1-ヒドロ

反応させることにより行なわれる。 キシベンズトリアソール (HOB t) を用いるか用いないで、0~40℃で

ゴン、強素等)雰囲気下、無水条件で行なうことが望ましい これら (1)、(2) および(3)の反応は、いずれも不活性ガス(アル

方法により行なうことができる。 水酸甚、アミノ甚またはチオール甚の保護甚の脱保護反応は前記と同様の

一般式 (IA) で示される化合物は、一般式 (IIC)

$$\mathbb{R}^{42\cdot 1}$$
 \mathbb{C} $\mathbb{R}^{42\cdot 1}$ $\mathbb{R}^{3\cdot 1}$ $\mathbb{R}^{3\cdot 1}$ $\mathbb{R}^{3\cdot 1}$ $\mathbb{R}^{3\cdot 1}$

(式中、すべての記号は前記と同じ意味を嵌わす。)で示される化合物と、

5 一段共 (IID)

っても製造することができる。 (式中、すべての記号は前記と同じ意味を扱わす。) で示される化合物をア ド化反応に付し、さらに必要に応じて保護基の既保護反応に付すことによ

- 15 アミド化反応は公知であり、例えば、
- (1) 酸ハライドを用いる方法、
- (2) 混合酸無水物を用いる方法

(3) 縮合剤を用いる方法等が挙げられる。

ű

WO 03/099765

PCT/JPHJ/H6678

これらの方法を具体的に説明すると、

- 5 イド等)と-20℃~遠流温度で反応させ、得られた酸ハライドを塩菇(ビ オキサン、テトラヒドロフラン等)中、アルカリ水溶液(簠曹水または水酸 ロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等)中、 ジイソプロピルエチルアミン等)の存在下、アミンと不活性有機熔媒(クロ リジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン、 または無溶媒で、酸ハライド化剤(オキザリルクロライド、チオニルクロラ ロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等)中 により行なうこともできる。 化ナトリウム溶液等)を用いて、酸ハライドと0~40℃で反応させること 0~40℃の温度で反応させることにより行なわれる。また、有機溶媒(ジ (1) 酸ハライドを用いる方法は、例えば、カルボン酸を有機溶媒 (クロ
- 20 2 ジメチルアミノビリジン、ジインプロピルエチルアミン等)の存在下、酸! 中または無路媒で、塩基(ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、 ロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン特) ロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中、アミンと0~4 または酸誘導体(クロロギ酸エチル、クロロギ酸インプチル等)と、 0~4 ライド (ピパロイルクロライド、トシルクロライド、メシルクロライド等)、 0℃で反応させることにより行なわれる。 0℃で反応させ、得られた混合酸無水物を有機溶媒(クロロホルム、ジクロ (2) 混合酸無水物を用いる方法は、例えば、カルボン酸を有機溶媒(ク
- ટ チルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノビリジン等) の存在下また は非存在下、縮合剤(1、3ージシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、 ル、テトラヒドロフラン等)中、または無溶媒で、塩基(ピリジン、トリエ (クロロホルム、ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド、ジエチルエーテ (3) 結合剤を用いる方法は、例えば、カルボン酸とアミンを、有機溶媒

反応させることにより行なわれる。 キシベンズトリアソール (HOB t) を用いるか用いないで、0~40℃で DC) 、1, 1' ーカルボニルジイミダゾール (CDI) 、2-クロロ-1 ーメチルピリジニウムヨウ栞、1ープロピルホスホン酸環状無水物 1ーエチルー3ー [3ー(ジメチルアミノ)プロピル] カルボジイミド (E (1-propanephosphonic acid cyclic anhydride、PPA) 等)を用い、1ーヒドロ

ゴン、密索等) 雰囲気下、無水条件で行なうことが望ましい。 これら (1)、(2) および(3) の反応は、いずれも不活性ガス(アル

なうことができる。 水酸基またはアミノ基の保護基の脱保護反応は前記と同様の方法により行

5

一般式(IB)で示される化合物は、一般式(IIA)で示される化合物と、一

味を扱わす。)で示される化合物をアミド化反応に付し、さらに必要に応じ が必要な場合には保護されているものとする。その他の記号は前記と同じ意 およびR441によって扱わされる基に含まれる水酸基、またはアミノ基は保護 て保護基の脱保護反応に付すことにより製造することができる。 (式中、R⁴⁸⁻¹およびR⁴⁴⁻¹は、R⁴³およびR⁴⁴と同じ意味を表わすが、R⁴³⁻¹

15

アミド化反応は前記と同様の方法により行なうことができる。

方法により行なうことができる。 アミノ基またはチォール基の保護基の脱保護反応は前記と同様の

20

反応に付し、さらに必要に応じて保酸基の脱保酸反応に付すことにより製造 することができる。 一般式 (IC) で示される化合物は、一般式 (IIA) で示される化合物を還元

> 5 剤(ジボラン、ボラン・ピリジン錯体、ボラン・メチルスルフィド錯体、水 化ホウ素カルシウム等)と0~60℃で反応させることにより行なわれるか、 られた化合物を溶媒(メタノール、テトラヒドロフラン、水等)中、還元剤 オニルクロライド等)、酸無水物(無水酢酸等)、または酸誘導体(クロロ リン等)の存在下または非存在下、酸ハライド(オキザリルクロライド、チ または無溶媒で、塩基(ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、 ロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等)中 半酸エチル、クロロ半酸イソプチル等)と、-20~60℃で反応させ、得 ジメチルアミノピリジン、ジイソプロピルエチルアミン、NIメチルモルギ (2) カルボン酸を有機溶媒(テトラヒドロフラン、トルエン等)中、還元 (水寮化ホウ紫ナトリウム、水築化ホウ紫テトラプチルアンモニウム、水築 この還元反応は公知であり、例えば、 (1) カルボン酸を有機溶媒 (クロ

ᇹ 方法により行なうことができる。 水酸基、アミノ基またはチオール基の保護基の脱保護反応は前記と同様の

繋化ジイソプチルアルミニウム等)と−80~0℃で反応させることにより

行なわれる。

あるか、あるいは公知の方法により容易に製造することができる。 一般式 (II) 、 (IIA) および (IIC) で示される化合物は、それ自体公知で

20 式1で示される方法により製造することができる。 一般式 (II) 、 (IIA) および (IIC) で示される化合物は、以下の反応工程

トシルオキシ基等を意味する。)を表わし、その他の記号は前記と同じ意味 反応工程式中、Xは脱離基 (脱離基とは、ハロゲン原子、メシルオキシ基

WY 工程子7

反応工程式1中、出発原料または試薬として用いる一般式 (III)、(IV)、(VI)、(VIII)、および (IID) で示される化合物は公知であるか、あるいは公知の方法により容易に製造することができる。

S

きる。特製は各反応ごとに行なってもよいし、いくつかの反応終了後に行なってもよい。

[毒性]

一般式 (1) で示される本発明化合物の器性は十分に低いものであり、医 薬品として使用するために十分安全であることが確認された。

産業上の利用可能性

[医薬品への適用]

一般式 (1) で示される本発明化合物は、LPA受容体に拮抗することに 10 より、泌尿器系疾患、癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障 専による疾患または脳関連疾患などの予防および/または治療に有用である と考えられる。

泌尿器系疾患としては、例えば、前立腺肥大症または神経因性膀胱疾患に 伴う症状(排尿困難(排尿開始運延、排尿時間延長、尿袋細小、間欠排尿、

- 15 二段排尿など)、頻尿、夜間頻尿、排尿痛など)、脳血管障害、パーキンソン病、脳腫瘍、多発性硬化症、シャイードレーガー(Shy-Drager)症、脊髄腫瘍、排間板ヘルニア、脊柱管狭窄症、糖尿病などに起因する症状(排尿困腫(排尿開始運延、排尿時間延長、尿線細小、間欠排尿、二段排尿など)、頻尿、夜間頻尿、排尿痛など)、下部尿路症(例えば、下部尿路の閉癌疾患など)、下部尿路の炎症性疾患(感染など)、多尿などが考えられる。
- 抵関連疾患としては、例えば、固形腫瘍、固形腫瘍転移、血管森維腫、骨 低腫、多発性骨髄腫、カポジ肉腫、白血病などが挙げられる。固形腫瘍の中 には、乳癌、肺癌、胃癌、食道癌、結腸直腸癌、肝燥癌、卵巣癌、卵胞膜細 胎腫、男性胚腫、頚部癌、子宮内膜癌、前立腺癌、腎臓癌、皮膚癌、骨肉腫、
- 25 膵臓癌、尿路癌、甲状腺癌、脳腫瘍などが挙げられる。また、癌の浸潤転移 もLPA受容体拮抗剤によって抑制されると考えられる。

症)、動脈閉塞症、肺線維症などが挙げられる。 形成(パセドウ病を含む)、肺炎症、ネフローゼ症候群、および骨粗しょう 狭窄、糖尿病性網膜症、血管新生性綠内障、後水晶体機維増殖症、甲状腺過 増殖性疾患としては、例えば、異常な血管新生を伴なう疾患(例えば、再

- S ン (Sjogren) 症候群などが挙げられる。 が挙げられ、自律神経系異常による分泌障害としては、例えば、シェーグレ ど)、その他の炎症・免疫異常による腎炎、肝炎、肺炎症などが挙げられる。 分泌障害による疾患としては、例えば、自律神経系異常による分泌障害等 炎症・免疫性疾患としては、例えば、乾癬、腎症(例えば、IgA腎症な
- 5 などが挙げられる。 脳関連疾患としては、例えば、脳梗塞、脳溢血、脳あるいは末梢神経障害
- らの非路性塩は、 一般式(1)で示される本発明化合物、それらのプロドラッグまたはそれ
- 1) その化合物の予防および/または治療効果の補完および/または増強。
- 2 2) その化合物の動態・吸収改善、投与量の低減、

および/または

- 3) その代合物の副作用の軽減
- のために他の媒剤と組み合わせて、併用剤として投与してもよい。
- 20 中に両成分を配合した配合剤の形態で按与してもよく、また別々の製剤にし 同時投与および時間差による投与が含まれる。また、時間差による投与は、 てもよいし、他の薬剤を先に投与し、一般式(1)で示される本発明化合物 一般式(1)で示される本発明化合物を先に投与し、他の薬剤を後に投与し て投与する形態をとってもよい。この別々の製剤にして投与する場合には、 一般式 (I) で示される本発明化合物と他の薬剤の併用剤は、1つの製剤
- 25 を役に投与してもかまわず、それぞれの投与方法は同じでも異なっていても

されず、一般式(1)で示される本発明化合物の予防および/または治療効 果を補完および/または増強する疾患であればよい。 上配併用剤により、予防および/または治療効果を奏する疾患は特に限定

5 られる。 等が挙げられる。ただし、抗コリン剤は前立腺肥大を伴わない場合にのみ用 抗コリン剤、5αーリダクターゼ阻容剤、および/または抗アンドロゲン剤 および/または治療効果の補完および/または増強のための他の薬剤として いられる。主として前立腺肥大を伴わない場合の頻尿、尿失禁の治療に用い は、他の泌尿器疾患治療剤、例えば、他のLPA受容体拮抗剤、α 1 遮断剤、 例えば、一般式(1)で示される本発明化合物の泌尿器疾患に対する予防

は、例えば、他の癌疾患治療剤等が挙げられる。 および/または治療効果の補完および/または増強のための他の薬剤として 例えば、一般式(1)で示される本発明化合物の癌疾患領域に対する予防

5 ーインキサンリラ] ベンジラ) メアファニラ) プロパノエート母が発げられ (2ークロロフェニル) エトキシ] カルボニル) アミノ) ー 3ーメチルー 5

他のLPA受容体拮抗剤としては、メチル3- ((4- [4- ()[1-

ナフトピジル、塩酸アルフソシン、AIO-8507L 毎が挙げられる 酸タムスロシン、メシル酸ドキサンシン、塩酸プランシン、インドラミン、 α 1 遮断剤としては、塩酸テラゾシン、塩酸プナゾシン、ウラビジル、塩

20

UK-112166-04、KRP-197、ダリフェナシン、YM-905 母が挙げられる。 プチルスコポラミン、酒石酸トルテロジン、塩化トロスピウA、Z-338、 塩酸プロピベリン、臭化プロバンテリン、臭化メチルベナクチジウム、臭化 抗コリン剤としては、例えば、塩酸オキシブチニン、塩化ベタネコール、

25 等が挙げられる。 5αーリダクターゼ阻害剤としては、例えば、フィナステリド、GI-998745

VO 03/099765

ピカルタミド母が挙げられる。 抗アンドロゲン薬としては、例えば、オキセンドロン、酢酸オサテロン、

ハカプトプリン、6ーメルカプロプリンボシド、フルオロウラシル、テガフ アラン、チオテバ、カルボロン、ブスルファン等)、ニトロンウレア誘導体 マスタードーNーオキシド、シクロホスファミド、イホスファミド、メルフ (塩酸ニムスチン、ラニムスチン等) 、代謝拮抗剤 (メトトレキサート、メ 他の癌疾患治療剤としては、例えば、アルキル化剤(塩酸ナイトロジェン

5 チノスタチン、ピラルビシン、エピルビシン、イダルビシン、クロモャイシ 塩酸ダウノルビシン、塩酸ドキソルビシン、塩酸アクラルビシン、ネオカル 酸プンプラスチン、硫酸アンクリスチン、硫酸アンデシン等)、ホテキン熱 ソV3、プレオタイシン、強硬ヘプロタイシンは)、荷物布アラカロイド(癌 (リン酸エストラムスチンナトリウム、メピチオスタン、エピチオスタノー

シタアン母)、花ガン在花虫物質 (アクテノゥイシンD、タイトゥイシンC、 ール、ユーエフティ、カルモフール、ドキシフルリジン、シタラピン、エノ

- 5 ラチン、カルボプラチン等)が挙げられる。 **レスチン、シゾフィラン、ウベニメクス、インターフェロン等)、その他(L ル、クエン酸タキキシフェン、リン酸ジエチプスチプベストロール、酢酸メ** ーアスパラギナーゼ、塩酸プロカルパジン、塩酸ミトキサントロン、シスプ ドロキシプログステロン等)、免疫強化剤(ワンチナン、アシパコープ、ク
- 20 一般式(1)で示される本発明化合物と他の薬剤の重盘比は特に限定され

他の薬剤は、任意の2種以上を組み合わせて数与してもよい。

果を補完および/または増強する他の薬剤には、上記したメカニズムに基ん また、一般式(1)で示される本発明化合物の予防および/または治療効

25 いて、現在までに見出されているものだけでなく今後見出されるものも含ま

> 発明化合物と他の薬剤の併用剤を上記の目的で用いるには、通常、全身的ま たは局所的に、経口または非経口の形で投与される。 ・殷式(1)で示される本発明化合物、または一般式(1)で示される本

好ましくは 0.1mgから 5 0mgの範囲で一日一回から数回非経口投与され つき、0.01mgから500mg、好ましくは0.1mgから100mg、さらに **餡囲で一日一回から数回経口投与されるか、または成人一人当たり、一回に** しくは0.1mgから500mg、さらに好ましくは0.1mgから300mgの なるが、通常、成人一人当たり、一回につき、0.01mgから1000mg、好ま 投与量は、年齢、体重、症状、治療効果、投与方法、処理時間等により異

投与凸より少ない量で十分な場合もあるし、また範囲を越えて投与の必要な もちろん前記したように、投与量は額々の条件により変動するので、上記 5

るか、または一日1時間から24時間の範囲で静脈内に持続投与される。

5 固形剤、内服用液剤および、非経口投与のための注射剤、外用剤、些剤、点 発明化合物と他の薬剤の併用剤を投与する際には、経口投与のための内服用 眼剤、吸入剤等として用いられる。 一般式(1)で示される本発明化合物、または一般式(1)で示される本

粒剤等が含まれる。カプセル剤には、ハードカプセルおよびソフトカプセル 経口投与のための内服用固形剤には、錠剤、丸剤、カプセル剤、散剤、顆

20 が含まれる。

晶セルロース、デンプン等)、結合剤(ヒドロキシプロピルセルロース、ポ そのままか、または賦形剤(ラクトース、マンニトール、グルコース、微結 リピニルピロリドン、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム等)、 崩壊剤(繊 このような内服用固形剤においては、ひとつまたはそれ以上の活性物質は

安定剤、溶解補助剤(グルタミン酸、アスパラギン酸等)等と混合され、常 **維索グリコール酸カルシウム等)、滑沢剤(ステアリン酸マグネシウム等)、**

25

法に従って契約化して用いられる。また、必要によりコーティング剤(白糖、ゼラチン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート等)で被覆していてもよいし、また2以上の層で被覆していてもよい。さらにゼラチンのような吸収されうる物質のカプセルも包含される。

S

経口投与のための内限用液剤は、薬剤的に許容される水剤、隠酒剤、乳剤、シロップ剤、エリキシル剤等を含む。このような液剤においては、ひとつまたはそれ以上の活性物質が、一般的に用いられる希釈剤(精製水、エタノールまたはそれらの混液等)に溶解、隠滴または乳化される。さらにこの液剤は、湿潤剤、隠滴化剤、乳化剤、甘味剤、風味剤、芳香剤、保存剤、緩衝剤等を含有していてもよい。

5

非経口投与のための外用剤の剤形には、例えば、軟質剤、ゲル剤、クリーム剤、温布剤、貼付剤、リニメント剤、噴霧剤、吸入剤、スプレー剤、エアソル剤、点眼剤、および点鼻剤等が含まれる。これらはひとつまたはそれ以上の活性物質を含み、公知の方弦または通常使用されている処方により顕製される。

2

軟務剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に引和、または溶融させて調製される。 軟膏基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。

20 例えば、

高級脂肪酸または高級脂肪酸エステル (アジピン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸、アジピン酸エステル、ミリスチン酸エステル、バルミチン酸エステル、ステアリン酸エステル、オレイン酸エステルでの)、ロウ類 (ミツロウ、鯨ロウ、セレシン等)、界面活性剤 (ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸エステル等)、高級アルコール (セタノール、ステアリルアルコール、セトステアリルアルコール等)、シリコン

25

油(ジメチルボリシロキサン等)、炭化水紫類(銀水ワセリン、白色ワセリン、精製ラノリン、流動パラフィン等)、グリコール類(エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ボリエチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ボリエチレングリコール、マクロゴール等)、植物油(ヒマシ油、オリーブ油、ごま油、テレビン油等)、動物油(ミンク油、卵黄油、スクワラン、スクワレン等)、水、吸収促造剤、かぶれ防止剤から強ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。さらに、保温剤、保存剤、安定化剤、抗酸化剤、潜音剤等を含んでいてもよい。

ゲル剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に溶融させて調製される。ゲル基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、低級アルコール (エタノール、インプロピルアルコール等)、ゲル化剤(カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシブロピルをルロース、ヒドロキシブロピルをルロース、エチルセルロース等)、中和剤(トリエタノールアミン、ジインプロース、エチルセルロース等)、中和剤(トリエタノールアミン、ジインプロース、エチルセルロース等)、中和剤(トリエタノールアミン、ジインプロース、エチルセルロース等)、中和剤(トリエタノールアミン・ジインプロース、エチルセルロース等)、中和剤(トリエタノールアミン・ジインプロース、エチルをルロース等)、水の吸促造剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。さらに、保存剤、抗酸化剤、着香剤等を含んでいてもよい。

クリーム剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えれ、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に溶脱または乳化させて調製される。クリーム基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、高級脂肪酸エステル、低級アルコール、炭化水素類、多価アルコール (プロピレングリコール、1,3一プチレングリコール等)、高級アルコール (2ーヘキシルデカノール、セタノール等)、乳化剤 (ポリオキシエチール (2ーヘキシルデカノール、セタノール等)、乳化剤 (ポリオキシエチーンアルキルエーテル類、脂肪酸エステル類等)、水、吸収促進剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。さらに、

保存剤、抗酸化剤、焙香剤等を含んでいてもよい。

湿布剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に溶融させ、練合物とし支持体上に 風延塗布して製造される。 忽布基剤は公知あるいは通常使用されているもの から避ばれる。 例えば、 増粘剤(ポリアクリル酸、ポリピニルピロリドン、 アラピアゴム、デンプン、ゼラチン、メチルセルロース等)、 湿潤剤(尿薬、 グリセリン、 プロピレングリコール等)、 充填剤(カオリン、酸化亜鉛、 タルク、カルシウム、マグネシウム等)、 水、溶解補助剤、粘糖付与剤、かぶ れ防止剤から選ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。 さらに、 保存剤、 抗酸化剤、 維香剤等を含んでいてもよい。

v

貼付剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に溶融させ、支持体上に展延資布して製造される。貼付剤用基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、高分子基剤、油脂、高級脂肪酸、粘着付与剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。さらに、保存剤、抗酸化剤、着香剤等を含んでいてもよい。

2

5

リニメント剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物を水、ブルコール(エタノール、ポリエチレングリコール等)、高級脂肪酸、グリセリン、セッケン、乳化剤、懸氮化剤等から選ばれるもの単独または2種以上に溶解、懸氮または乳化させて調製される。さらに、保存剤、抗酸化剤、益香剤等を含んでいてもよい。噴霧剤、吸入剤、およびスプレー剤は、一般的に用いられる希釈剤以外に正硫酸水菜ナトリウムのような安定剤と等張性を与えるような緩衝剤、例えば塩化ナトリウム、クエン酸ナトリウムあるいはクエン酸のような等現剤を含有していてもよい。スプレー剤の製造方法は、例えば米国特許第 2,868,691 号および同第 3,095,355 号に詳しく記載されている。

20

非経口投与のための注射剤としては、溶液、懸濁液、乳濁液および用時溶剤に溶解または懸濁して用いる固形の注射剤を包含する。注射剤は、ひとつまたはそれ以上の活性物質を溶剤に溶解、懸濁または乳化させて用いられる。溶剤として、例えば注射用蒸留水、生理食塩水、植物池、プロビレングリコ5 ール、ポリエチレングリコール、エタノールのようなアルコール類等およびそれらの組み合わせが用いられる。さらにこの注射剤は、安定剤、溶解補助剤(グルタミン酸、アスパラギン酸、ポリソルベート80(登録商標)等)、懸濁化剤、乳化剤、無痛化剤、緩衝剤、保存剤等を含んでいてもよい。これらは最終工程において減菌するか無菌操作法によって製造される。また無菌の固形剤、例えば凍結乾燥品を製造し、その使用前に無菌化または無菌の注射用蒸留水または他の溶剤に溶解して使用することもできる。

非経口投与のための点眼剤には、点眼液、慇獨型点眼液、乳濁型点眼液、用時溶解型点眼液および眼軟香が含まれる。

25 20 2 ベート80(商品名)、ステアリン酸ポリオキシル40、ポリオキシエチレ ン硬化ヒマシ油等)、安定化剤(クエン酸ナトリウム、エデト酸ナトリウム それ以上の活性物質を溶剤に溶解、懸濁または乳化させて用いられる。点眼 菌操作法によって製造される。また無菌の固形剤、例えば凍結乾燥品を製造 適宜選択して含んでいてもよい。これらは最終工程において滅菌するか、無 等)、防腐剤(塩化ベンザアコニウム、パラベン等) 尊などを必要に応じた 衝化剤(リン酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等)、 界面活性化剤(ポリンル 用いられる。点眼剤は、等張化剤(塩化ナトリウム、潑グリセリン等)、 綴 たは注射用非水性用剤(例えば、植物油等)等およびそれらの組み合わせが 剤の溶剤としては、例えば、滅菌精製水、生理食塩水、その他の水性溶剤ま 使用することもできる。 これらの点眼剤は公知の方法に準じて製造される。例えば、ひとつまたは その使用前に無菌化または無菌の滅菌精製水または他の溶剤に溶解して

入用液剤が含まれ、当該吸入用液剤は用時に水又は他の適当な媒体に溶解又 は隠緧させて使用する形質であってもよい。 非経口投与のための吸入剤としては、エアロゾル剤、吸入用粉末剤又は吸

これらの吸入剤は公知の方法に準じて製造される

マー等)、吸収促進剤などを必要に応じて適宜選択して調製される 化剤(塩化ナトリウム、磯グリセリン等)、 増粘剤(カリボキシピニルポリ ン特)、 帯色剤、緑筋化剤(リン酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等)、 等張 例えば、吸入用液剤の場合には、防腐剤(塩化ベンザルコニウム、パラベ

| 対(デンプン、デキストリン等)、 賦形剤(乳糖、セルロース等)、 雑色剤、 防腐剤(塩化ベンザルコニウム、パラベン等)、吸収促造剤などを必要に応 じて適宜過択して調製される。 吸入用粉末剤の場合には、滑沢剤(ステアリン酸およびその塩等)、結合

5

が使用され、吸入用粉末剤を投与する際には通常粉末薬剤用吸入投与器が使 吸入用液剤を投与する際には通常噴霧器(アトマイザー、ネプライザー)

5

物質を含み、常法により処方される舌下投与のための舌下剤、直腸内投与の ための丝剤および脳内投与のためのペッサリー体が含まれる。 非超口投与のためその他の組成物としては、ひとつまたはそれ以上の活性

等の固形製剤、軟膏剤等が挙げられる。 薬剤を局所的に供給できればよく、その投与方法に限定されない。例えば、 筋肉内、皮下、躁器、関節部位などへの注射剤、埋め込み剤、顆粒剤、散剤 一般式(1)で示される本発明化合物の局所投与としては、疾患の部位へ

20

患の部位で、媒剤を持続的に供給できればよく、その製剤に限定されない。 一般式(1)で示される本発明化合物の特続性製剤としてはとしては、疾

例えば、徐放性注射剤(例えば、マイクロカプセル製剤、マイクロスフェア 契剤、ナノスフェア製剤等)、 埋め込み製剤(例えば、フィルム製剤等)等

25

式(1)で示される本発明化合物と他の薬剤の併用剤を含有し、生体内分解 剤とは、括性成分として一般式 (I) で示される本発明化合物、または一般 上記したマイクロカプセル製剤、マイクロスフェア製剤、ナノスフェア製

性重合物との微粒子状の医薬組成物である。

5 きる。脂肪酸エステル蜇合体またはその共宜合体とは、ポリ乳酸、ポリグリ オキサレート類、ポリオルソエステル、ポリカーボネートおよびポリアミノ 合体、ポリアクリル酸エステル類、ポリヒドロキシ酪酸類、ポリアルキレン 酸類が挙げられ、これらは1種類またはそれ以上混合して使用することがで 本発明の生体内分解性重合物とは、脂肪酸エステル重合体またはその共重

2 体であり、より好ましくは、乳酸ーグリコール酸共宜合体である。 好ましくは、ポリ乳酸、ポリグルコール酸または乳酸ーグリコール酸共宜合 ポリトリメチレンオキサート、ポリオルンエステル、ポリオルンカーボネー その他に、ポリαーシアノアクリル酸エステル、ポリβーヒドロキシ酪酸、 が挙げられ、これらは1種類またはそれ以上混合して使用することができる コール酸、ポリクエン酸、ポリリンゴ酸および乳酸ーグリコール酸共宜合体 びポリレーアラニンの1種類またはそれ以上混合も使用することができる。 ト、ポリエチワンカーボネート、ポリッーベンジルーローグルタミン酸およ

20 25 2,000 ないし約 800,000 のものが好ましく、より好ましくは約 5,000 ないし約 から約 100,000 のものが好ましい。さらに好ましくは約 6,000 から約 50,000 200,000 である。例えば、ポリ乳酸において、その宜盘平均分子量は約 5,000 0/0から約50/50 (W/W) が好ましく、特に約90/10から50/ コール酸井重合物においては、その乳酸とグリコール酸との組成比は約10 である。ポリ乳酸は、自体公知の製造方法に従って合成できる。乳酸ーグリ 本発明に使用されるこれらの生体内分解性高分子组合物の平均分子母は約

50 (W/W) が好ましい。乳酸ーグリコール酸共宜合物のឮ盘平均分子盘は

約 5,000 から約 100,000 が好ましい。さらに好ましくは約 10,000 から 80,000 である。乳酸ーグリコール酸共宜合物は、自体公知の製造方法に従って合成

ー (GPC) で湖定したポリステレン検算の分子点をいう。 本明細番中、血量平均分子型は、ゲルパーミェーションクロマトグラフィ

S

放出によって変えることができる。例えば当該生理活性物質に対して約 0.2 ないし 10,000 倍 (血量比) の畳で用いられ、好ましくは約1ないし 1,000 倍 一般式(1)で示される本発明化合物の薬理活性の強さと、目的とする薬物 (西景比)、さらに好ましくは約1ないし100倍 (重畳比)の魚で用いる 前記した生体内分解性高分子重合物は、本発明の目的が違成される限り、

発明を実施するための最良の形態

5

のがよい。

以下、参考例および実施例によって本発明を詳述するが、本発明はこれら

2

に限定されるものではない。

ている。 NMRの箇所に示されているカッコ内の容媒は、測定に使用した容媒を示し 容媒は、使用した浴出溶媒または展開溶媒を示し、割合は体積比を衷わす。 クロマトグラフィーによる分離の箇所、TLCに示されているカッコ内の

参考例1

20

3- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノプロバン酸 エチルエ

ステル 塩酸塩

タノール(25m1)に容解し、室温にて3日間撹拌した。減圧下エタノー ルを除去し、得られた残弦に4N塩化水栗 「酢酸エチル溶液を加えた。 域圧 4ーエトキシフェネチルアミン(2.2g)とアクリル酸エチル(1.5g)をエ

25

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

下の物性値を有する標題化合物 (4.0g) を得た。 下榕娸を留去し、得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄して、以

TLC: Rf 0.89 (クロロホルム:メタノール=9:1);

NMR(DMSO- d_6): δ 9.10 (brs, 2H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 2H), δ .87 (d, J = 8.7 Hz,

2H), 4.11 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.99 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.40 - 3.00 (m, 4H), 3.00 - 2.85(m, 2H), 2.79 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 1.31 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.21 (t, J = 7.2 Hz, 3H)

3- (N- ((2-(2-カルボキシフェニル) フェニル) カルボニル) -

5 N-(2-(4-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸 エチル

g) およびトリエチルアミン (0.85ml) を塩化メチレン (10ml) に溶解 し、室温にて一晩撹拌した。反応混合物を酢酸エチルと1N塩酸の混合液に 参場例1で製造した化合物(600mg)、ジフェン酸無水物(538m

5 加え、水層を酢酸エチルにて抽出した。有機層を合わせ、飽和炭酸水森ナト た。溶媒を留去して、以下の物性値を有する標題化合物(837mg)を得 リウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し

TLC:Rf 0.50 (クロロホルム:メタノール=9:1);

20 3.80-3.00 (m, 4H), 2.60-2.00 (m, 4H), 1.35-1.05 (m, 6H). NMR (DMSO-46): 87.90-7.15 (m, 8H), 7.00-6.70 (m, 4H), 4.00-3.90 (m, 4H),

3- (N- ((2-(2-((ビリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

25 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニ ル) エチル) アミノ) プロパン酸 エチルエステル

PC1/JP03/06678

参考例2で製造した化合物(150mg)、3-ピコリルアミン(50mg)および1-エチルー3ー [3-(ジメチルアミノ)プロピル]カルボジイミド塩酸塩(180mg)を塩化メチレン(5m1)に溶解し、塩温にて一晩撹拌した。反応混合物を酢酸エチルと1N塩酸の混合溶媒に加え、水圏

5 を酢酸エチルにて抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水にて洗浄した後無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:酢酸エチル=1:2) にて精製して、以下の物性値を有する本発明化合物 (147mg)を得た。

TLC:Rf 0.20(クロロホルム:酢酸エチル=3:2);

10 NMR (DMSO-d₆): 8 9.00-8.10 (m, 2H), 7.60-6.75 (m, 17H), 4.40-3.90 (m, 4H), 3.80-3.10 (m, 4H), 2.80-2.05 (m, 4H), 1.40-1.30 (m, 3H), 1.20-1.10 (m, 3H),

裏施例1 (1) ~ (4)

4ーエトキシフェネチルアミンの代わりに相当するアミンを用いて、参考 12 例1→参考例2で示される方法と同様に操作し、さらに相当するアミンを用 いて、実施例1で示される方法と同様に操作して、以下に示す本発明化合物 された

夷施例1 (1)

- 20 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 エチルエステル TLC:Rf 0.14 (クロロホルム:酢酸エチル=1:1)。

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

ル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸 エチルエステル

TLC:Rf 0.91 (塩化メチレン:メタノール=9:1);

NMR (DMSO-d₆): δ 9.10-8.60 (m, 1H), 7.60-6.70 (m, 17H), 4.40-3.80 (m, 6H), 3.80-3.00 (m, 4H), 2.80-2.00 (m, 4H), 1.40-1.20 (m, 3H), 1.20-1.10 (m, 3H),

実施例1 (3)

3ー(N-((2-(2-(メチルアミノカルボニル)フェニル)フェニル) カルボニル)-N-(2-(4-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロ

10 パン酸 エチルエステル

TLC:Rf 0.62 (塩化メチレン:酢酸エチル=2:1); MASS (APCI, Pos., 40V):503 (M+H)⁺。

夷施例1. (4)

15 3-(N-((2-(2-(ベンジルアミノカルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルエチルアミノ))プロバン酸 エチルエステル

TLC:Rf 0.73 (塩化メチレン:酢酸エチル=4:1);

MASS (APCI, Pos., 40V) : 535 (M+H)+

実施例2

20

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

25 実施例1で製造した化合物(110mg)と1N水酸化ナトリウム水溶液(0.5m1)をエタノール(1m1)とテトラヒドロフラン(2m1)の混合

溶媒に溶解し、窒温にて2時間撹拌した。反応混合物を酢酸エチルと1N塩酸の混合溶媒に加え、水層を酢酸エチルにて抽出した。有機屬を合わせ、飽和食塩水にて洗浄した後無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去して、以下の物性値を有する本発明化合物(11mg)を得た。

5 TLC:Rf 0.36 (クロロホルム:メタノール=9:1);
NMR(DMSO-d₆): 89.00-8.30 (m, 2H), 7.60-6.70 (m, 15H), 4.60-4.10 (m, 2H), 4.00-3.90 (m, 2H), 3.90-3.00 (m, 4H), 2.80-2.65 (m, 2H), 2.20-2.00 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 3H)。

10 実施例2(1)~(4)

実施例1で製造した化合物の代わりに実施例1 (1)~(4)で製造した化合物を用いて、実施例2で示される方法と同様に操作して、以下に示す本発明化合物を得た。

15 夹施例2 (1)

3- (N-((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

TLC:Rf 0.56 (クロロホルム:メタノール=9:1);

20 NMR (DMSO-d₆, 100°C): δ 8.55 (brs, 1H), 8.48 (dd, J = 1.2, 4.8 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.60-6.95 (m, 12H), 6.81 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.30-4.20 (m, 2H), 3.73 (s, 3H), 3.50 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.42 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.80-2.60 (m, 2H), 2.20-2.10 (m, 2H).

3- (N- ((2-(2-(ベンジルアミノカルボニル) フェニル) フェニ

S

WO 03/099765

PC1/JP03/06678

ル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

TLC:Rf 0.67 (クロロホルム:メタノール=9:1);

NMR (DMSO-4₆): δ 9.10-8.60 (m, 1H), 7.60-6.70 (m, 17H), 4.40-3.80 (m, 4H), 3.80-3.00 (m, 4H), 2.80-1.90 (m, 4H), 1.40-1.20 (m, 3H),

実施例2 (3)

3- (N- ((2- (2- (メチルアミノカルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロ

10 パン酸

TLC: Rf 0.53 (クロロホルム:メタノール=9:1);
NMR(DMSO-46): δ8.50-8.00 (m, 1H), 7.60-6.70 (m, 12H), 4.00-3.90 (m, 2H), 3.80-3.00 (m, 4H), 2.80-2.00 (m, 7H). 1.40-1.30 (m, 3H)。

15 夷施例2 (4)

3- (N- ((2- (2- (ベンジルアミノカルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロバン酸 TLC:Rf 0.47 (クロロホルム:メタノール=9:1); MASS (APCI, Neg., 40V): 505 (M-H)。

20

参考例3

固相担特アクリル酸エステル

アルゴン祭囲気下、ポリスチレン担持 Wang 樹脂(アルゴノート社製、カタログ番号 800296) (1.06mm o 1 / g、10.0 g)の塩化メチレン(1 0 0 m 25 1)懸滴液に、N, Nージイソプロピルエチルアミン(9.17m 1)とアクリル酸クロリド(2.58m 1)を一78℃にて加え、窒温にて16時間損拌した。反

応混合物から樹脂を趙取し、塩化メチレン(150m1×4)およびNーメチルー2ーピロリドン(100m1×3)にて洗浄して、固相担持アクリル酸エステルを得た。

参考例4

S

固相担持3-(2-(2,5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノプロバン酸エステル

参考例 3 で製造した化合物のNーメチルー2ーピロリドン(100ml) 裕液に2,5ージメトキシフェネチルアミン(9.60g)を加え、室温にて26時間撹拌した。反応混合物から抽脂を随取し、Nーメチルー2ーピロリドン

5

(100m1×3) および塩化メチレン (100m1×4) にて充浄した。 (100m1×3) および塩化メチレン (100m1×4) にて充浄した。 得られた樹脂を放圧下乾燥して、固相担持3-(2-(2,5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノブロバン酸エステルを得た (13.70g)。

物站空5

2

固柏担枠 3 ー (N-((2-(2-カルボキシフェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸エステル

参考例4で製造した化合物 (4.00g) のNーメチルー2ーピロリドン (400m) 肥満液にジフェン酸無水物 (6.93g) を加え、窒温にて16時間撹拌した。反応混合物から樹脂を適取し、N, Nージメチルホルムアミド (50m 1×5) にて洗浄して、固相担持3ー (Nー((2ー(2ーカルボキシフェニル)フェニル) フェニル) カルボニル)ーNー(2ー(2,5ージメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸エステルを得た。

参考例6

25

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

固柏柏特3-(N-((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)ーN-(2-(2,5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸エステル

参考例5で製造した化合物のN、Nージメチルホルムアミド(40m1) 5 溶液に、4-クロロペンジルアミン(3.76m1)、1ーにドロキシベンズトリ アゾールー水和物(4.73g)およびN、Nージインプロピルカルボジイミド (4.84m1)を加え、留温にて16時間携件した。反応混合物から樹脂を適取 し、N、Nージメチルホルムアミド(50m1×3)、塩化メチレン(50m1×3)、メタノール(50m1×2)および塩化メチレン(50m1×3)、メタノール(50m1×2)および塩化メチレン(50m1×3)にて順次洗浄して、固相担持3-(N-(2-(2-(4-クロロ ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)ーN-(2 -(2,5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸エステルを

15 奥施例3

得た。

3- (N-((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) ガルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

参考例6で製造した化合物をトリフルオロ酢酸と水の混合溶媒(9:1,40ml)に懸濁し、窒温にて1時間撹拌した。反応混合物を濾過し、樹脂をトリフルオロ酢酸と水の混合溶媒(9:1,40ml)にて洗浄した。 減液を合わせ、減圧下濃縮して得られた残液をトルエン(20ml)にて2回共消した。得られた残液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチナ消した。得られた残液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:メタノール:酢酸=100:1:0.1)にて精製して、以下の物性値を有ル:メタノール:酢酸=100:1:0.1)にて精製して、以下の物性値を有

する本発明化合物(1.106g)を得た。 TLC:RI 0.27(酢酸エチル:メタノール:酢酸=100:1:0.1);

25

Š

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

NMR (DMSO-d₆) : δ 12.22 (s, 1H), 9.00-8.60 (m, 1H), 7.60-7.30 (m, 5H), 7.30-7.00 (m, 4H), 6.97 (m, 1H), 6.90-6.40 (m, 5H), 4.45-4.25 (m, 1H), 4.23-3.90 (m, 1H), 3.80-3.10 (m, 11H), 2.78 (m, 1H), 2.49 (m, 1H), 2.08 (m, 1H)

奥施例3 (1)

フェニル) エチル) アミノ) プロパン感 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキシ 3 — (N — ((2 — (2 — ((ピリジンー3ーイルメチルアミノ) カルボニ

参考例6→実施例3で示される方法と同様に操作し、さらに必要により公知 の方法によって相当する塩に変換して、以下の物性値を有する本発明化合物 4ークロロベンジルアミンの代わりに 3ーピリジルメチルアミンを用いて.

ಠ

フリー体:

TLC:Rf 0.57 (クロロホルム:メタノール:酢酸=9:1:0.5)

2 NMR(CD,OD): 8 8.61 (m, 1H), 8.34 (br, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.64-7.54 (m, 1H) 6.74-6.60 (m, 2H), 4.58 (d, J = 15.3Hz, 1H), 4.18 (d, J = 15.3Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 3.90-3.70 7.54-7.38 (m, 2H), 7.38-7.20 (m, 2H), 7.16-7.02 (m, 2H), 6.86-6.74 (m, 2H), 1H), 3.72 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.65-3.35 (m, 2H), 2.88 (m, 2H), 2.80-2.40 (br, 1H) 2.22 (t, J = 7.2Hz, 2H)

20

(m, 2H), 7.60-6.60 (m, 11H), 4.70-4.45 (m, 1H), 4.35-4.10 (m, 1H), 3.80-3.10 (m, NMR (DMSO-d₆): δ 9.20-8.90 (m, 1H), 8.79 (m, 1H), 8.70-8.30 (m, 1H), 8.10-7.70 11H), 2.85-2.60 (m, 1H), 2.55-2.30 (m, 1H), 2.25-1.95 (m, 1H)_°

参考例7

25

S

TLC:Rf 0.18 (酢酸エチル:メタノール:酢酸=90:9:0.2)

とアクリル酸クロリド (24.4m l) を-78℃にて加えた。反応混合物を竄温 ン (198ml) に加え、N, Nージイソプロピルエチルアミン (77.9ml) ード番号 SPPSLHMP) (16.0 μ m o 1 /ランターン、1000 本)を塩化メチレ 固相担特アクリル酸エステル 50ml×5)にて洗浄後風乾して、固相担持アクリル酸エステルを得た。 にて15時間撹拌した。反応混合物から固相担体を適取し、塩化メチレン(1 アルゴン雰囲気下、Lantern PS-Wang(登録商標)(ミモトープス社製、コ

5 固相担持3ーベンジルアミノプロバン酸エステル リドン(20m1×4)にて洗浄して、固相担持3-ペンジルアミノプロパ θ時間撹拌した。反応混合物から固相担体を遮取し、Nーメチルー2ーピロ ーメチルー2ーピロリドン溶液 (I.OM、15ml) 溶液に加え、窒温にて1 参考例 7 で製造した化合物 (4 5 本、0.72mm o 1) をペンジルアミンの N

2 ン酸エステルを得た。

参考例 9

20

ニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロバン酸エステル 固相担持3- (N- ((2- (2-カルボキシフェニル) フェニル) カルボ

- 応混合物を50℃にて60時間撹拌した。 反応混合物から固相担体を遮取し、 00m1×3) にて洗浄した。得られた固相担体を風乾して、固相担持3-N, Nージメチルホルムアミド(500m1×4)および埴化メチレン(5 ピロリドン (500m1) に加え、ジフェン酸無水物 (48.4g) を加えた。反 (N- ((2-(2-カルボキシフェニル) フェニル) カルボニル) -N-参考例8で製造した化合物(1350 本、21.6mm o 1)をNーメチルー2ー
- (ベンジル) アミノ) プロパン酸エステルを得た。

参站回10

固柏哲特 3 ー(N ー((2 ー(2 ー(3 ーメチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル)フェニル) カルボニル) ーN ー(ベンジル)アミノ) プロ

3 パン酸エステル

参写例9で製造した化合物(30本、0.48mmo1)をN、NージメチルホルAアミド(10m1)に加え、3ーメチルベンジルアミン(2.40mmo1)、1ーヒドロキシベンズトリアゾールー水和物(368mg)およびN、Nージイソプロビルカルボジイミド(0.376m1)を加えた。反応混合物を宮垣に

10 て16時間提押した。反応混合物から固相担体を適取し、N, N-ジメチルホルムアミド (10m1×3) および塩化メチレン (10m1×3) にて洗浄した。得られた固相担体を風乾して、固相担特3-(N-((2-(2-(2-(3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) フィニル) ファニル) カルボニル) フィニル) ファニル) カルボニル) ーN-(ベンジル) アミノ) プロバン酸エステルを得た。

夹施例4

2

3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボール) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロバン酸参纬例10で製造した化合物(1本、0.016mmo1) をトリフルオロ酢酸

20 (0.5m1)に加え、室温にて1時間処理した。固相担体を取り出し、トリフルオロ酢酸(0.5m1)で洗浄した。洗浄液を合わせ、減圧下凝縮して、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。高速液体クロマトグラフィー(HPLC)を用いた分析条件を以下に示す。

使用したカラム:Xterns(登録商標) MS Cis, 4.6×50mm I.D., 5μm, 100Å

使用した流速:3mL/min

25

使用した溶媒

WO 03/099765

A液:0.1%トリフルオロ酢酸水溶液

B液:0.1%トリフルオロ酢酸-アセトニトリル溶液

測定開始後 0.5 分間はA液とB液の混合比を95/5に固定した。その後2.5分間でA液とB液の混合比を0/100に直線的に変えた。その後0.5分間A液とB液の混合比を0/100に固定した。その後0.01分間でA液とB液の混合比を95/5に直線的に変えた。

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI,Pos.,20V) : 507 (M+H)+.

10 実施例4 (1) ~ (1154)

ベンジルアミンの代わりに相当するアミンを用いて、参考例8→参考例9で示される方法と同様に操作し、さらに3ーメチルベンジルアミンの代わりに相当するアミンを用いて、参考例10→実施例4で示される方法と同様に操作して、以下の本発明化合物を得た。

15 高速液体クロマトグラフィー (HPLC) を用いた分析条件を以下に示す。

HPLC条件A

使用したカラム:Xterra(登録商額) MS C₁₈, 4.6×50mm I.D., 5μm, 100 Å

使用した流速:3mL/min

使用した溶媒

20 A液: 0.1%トリフルオロ酢酸水溶液

B液:0.1%トリフルオロ酢酸-アセトニトリル溶液

測定開始後 0.5 分間はA液とB液の混合比を95/5に固定した。その後2.5分間でA液とB液の混合比を0/100に直線的に変えた。その後0.5分間A液とB液の混合比を0/100に固定した。その後0.01分間でA液とB

25 液の混合比を95/5に直線的に変えた。

HPLC条件B

使用したカラム:Phenomenex Max-RP, 2×50mm I.D., 4μm, 80 Å

使用した流速: 250 μ L / min

使用した溶媒

B液:0.05%ギ酸-アセトニトリル溶液

Ç

混合比を10/90に直線的に変えた。その後0.8分間A液とB液の混合比を B液の混合比を20/80に直線的に変えた。その後0.5分間でA液とB液の 10/90に固定した。その後1分間でA液とB液の混合比を95/5に直 測定開始時A液とB液の混合比を95/5にした。その後3.5分間でA液と

ö 線的に変えた。

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (1

2 Hーインドーバー 3ーイル) エチル)アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 586 (M+H)⁺.

20

ニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(1H-インドール-3-イル) 3ー (Nー ((2ー (2ー ((2ーフリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

HPLC測定条件:A

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.64分;

25

MASS 7-4 (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H).

6

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

フェニル) カルボニル) -N-(2-(1H-インドール-3-イル) エヂ 3 - (N - ((2 - (2 - ((1 - インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

ツ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASS $\neq -$ $(ESI, Pos., 20V) : 572 (M+H)^+$

5 **奥施例4 (4)**

ル) エチル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (1Hーインドールー3ーイ 3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間:3.89分;

MASS $\vec{\tau}$ - \not (ESI, Pos., 20V) : 596 (M+H) $^+$, 214,

寒施例4 (5)

3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドローβ-カルボ

20 リンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2 ー (1Hーインドールー3ーイル) エチル) アミノ) プロバン欧

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+

25

実施例4 (6)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(1 H-インドール-3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

S

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+

爽施例4 (7)

3- (N- ((2-(2-((ビリジン-3-イルメチルアミノ) カルボエ

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (1H-インドール-

3ーイブ) エチブ) アミノ) プロバン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+,

2

夷施例4 (8)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3- (N- ((2- (2- (ピリジン-4-イルメチルアミノ) カルボニ

3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC選定条件:A

HPLC保持時間:3.14分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+, 439,

25 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリン 2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー

೭

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

(1H-インドールー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 572 (M+H)+

実施例4 (10)

ル) エチル) アハノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル)・-N- (2- (1H-インドール-3-イ 3- (N- ((2-(2-((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

5

HPLC保持時間:3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)+。

実施例4 (11)

5 3- (N- ((2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ ェニル) カルボニル) ーNー (2ー (1Hーインドールー3ーイル) エチル) アペノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

20 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 546 (M+H)+

<u> 実施例4(12)</u>

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(1H-インドール-3-3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

25 イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)+.

夹施例4 (13)

3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ 万) エチラ) アミノ) プロスン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(1H-インドール-3-イ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)+

5

夷施例4 (14)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (1H-インドールー3-3- (N- ((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボール)

15 イバ) メチバ) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)*。

20 夷施例4 (15)

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (1Hーインドールー3ーイ 3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC保持時間: 3.86分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)⁺, 214。

S

ラ) メチラ) アミノ) プロパン酸 HPLC測定条件: A

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(1H-インドール-3-3- (N- ((2- (2- ((4-メトキツベンジルアミノ) カルボニル)

イラ) エチル) アミノ) プロパン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)+

5

ル) エチル) アミノ) プロパン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イ 3- (N- ((2- (2- ((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)+

実施例4 (18)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3ーイラ) エチラ) アッノ) アロベン類

20

HPLC測定条件:A HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)+

25

実施例4 (19)

6/8

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2- (2- ((N-インプロピル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC运汽条件:A

HPLC保持時間:3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 588 (M+H)+。

夹施例4 (20)

3- (N- ((2- (2- ((N-エチャーNーペンジルアミノ) カルボニ

10 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-

3ーイラ) エチラ) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 574 (M+H)+, 360。

衷施例4 (21)

5

3- (N- ((2- (2- ((N-ブチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N- (2- (1H-インドール-

3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 602 (M+H)+, 388, 214,

安施例4 (22)

25

3 - (N - ((2 - (2 - (4 - (ter-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N - (2 - (1H-インドールー

3ーイラ) エチラ) アペノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 602 (M+H)+.

実施例4 (23)

3- (N- ((2- (2- (((5-メチル-2-フリル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドールー3-イル) エチル) アミノ) プロバン酸

10 HPLC遗定条件: A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)+, 214.

爽施例4 (24)

15 3 - (N - ((2 - (2 - ((1 - フェニル - 3 - トリフルオロアセトキシ プロビルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (1 H - インドール - 3 - イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC認定条件: A

HPLC保持時間:3.98分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 686 (M+H)+。

奥施例4 (25)

3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(1H-インドールー3-

イブ) エチブ) アミノ) プロパン酸

25

HPLC測定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.77分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+

爽施例4 (26)

s 3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) イル) エチル) アミノ) プロバン酸 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(1H-インドール-3-

HPLC遊院保存:A

HPLC保持時間:3.77分;

5 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+.

夷施例4 (27)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(1H-インドール 3 - (N - ((2 - (2 - ((2, 5ージフルオロベンジルアミノ) カルボ

2 ー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.79分:

MASS=-> (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)+.

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3- (N- ((2- ·(2- (((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ (1Hーインドールー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン殴

20 夹施例4 (28)

HPLC泡定条件:A

HPLC保持時間: 3.58分;

25

MASS = - 4 (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H).

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2- (2- ((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イ

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)+.

5 夷施例4 (30)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(1H-インドール-3-3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) イラ) エチラ) アペノ) プロバン顋

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間:3.75分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)⁺.

実施例4 (31)

3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルポニル) フェニル) フェ

ニル) カルボニル) ーN-(2-(1H-インドール-3-イル)エチル)

アミノ) プロパン酸

20

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.56分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 496 (M+H) $^+$.

25

夷施例4 (32)

70

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

Hーインドールー 3ーイル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 574 (M+H)+.

実施例4 (36)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(1H-イン 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) ドールー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 578 (M+H)[†]

実施例4 (37)

5 3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ ル) エチル) アミノ) プロパン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (1Hーインドールー3ーイ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.71分;

20 MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)⁺, 214。

实施例4 (38)

3- (N- ((2-(2-(((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

エニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

25

HPLC保持時間: 3.71分; HPLC衡定条件:A ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(1H-インドール 3 - (N - ((2 - (2 - ((2, 6 - ジフルオロベンジルアミノ) カルボ ー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン徴

S

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)+.

奥施例4 (33) 3- (N- ((2- (2- ((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

5

ェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (1H-インドール-3-イ HPLC保持時間:3.86分; HPLC测定条件:A ハ) エチハ) アミノ) プロパン酸

夹施例4 (34)

5

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)+.

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ (1Hーインドールー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.58分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)+.

夷施例4 (35)

23 3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-(4ーメチルフェニル) エチ ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (1

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.48分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 602 (M+H)+;

HPLC保持時間:3.62分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 602 (M+H)+, 498.

夷施例4 (39)

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (1Hーインドールー3-イ 3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 ラ) エチラ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)+.

5 爽施例4 (40)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール 3- (N- ((2-(2-((3、5ージフルオロベンジルアミノ) カルボ

ー3ーイル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.82分;

MASSF-> (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)+.

夷施例4 (41)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルビリジン-2

25 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

NI(2-(1H-インドール-3-イル) エチル)アミノ) プロパン酸

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 575 (M+H)+.

夷施例4 (42)

-N-(2-(1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) 3— (N— ((2— (2— ((N— (2— (N, Nージメチルアミノ) エチ

5 HPLC保持時間: 3.44分;

HPLC測定条件:A

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)+,

実施例4 (43)

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルポニル) フ

ᅜ ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (1Hーインドールー3ーイ

ル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H) $^{+}$.

20

実施例4 (44)

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2 3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-デトラヒドロ-1-ナフチ 3ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

겁

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)⁺。

夷施例4 (45)

3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)

S アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2,

3ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC戀院条件:A

HPLC保持時間:3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+

5

爽施例4 (46) 3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

ニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,3-ジメトキシフェニル)

エチル) アペノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

15

HPLC保持時間:3.69分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H) $^+$.

爽施例4 (47)

8 フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2, 3ージメトキシフェニル) エチ 3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

ラ) アペノ) ノロバン類

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+

実施例4 (48)

ル) エチル) アミノ) プロパン酸 3ー (Nー ((2ー (2ー ((1ーナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシフェニ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

MASS = - 9 (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H).

寒施例4 (49)

5 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ フェニル)エチル)アミノ)プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.23分;

5 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)+.

夷施例4 (50)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 3-ジメトキシ 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

20 フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)+.

25 **奥施例4 (51)**

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2-

(2, 3ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)[†]

S

夷施例4 (52)

3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニ

10 ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HP LC透点条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

15 夷施例4 (53)

3- (N- ((2-(2-(ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 3-ジメトキシフェニル) エチル)

アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

夷施例4 (54)

3 - (N- ((2 - (2 - ((2 - メトキシベンジルアミノ) ガルボニル)

25 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

PCT/

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+.

5 実施例4 (55)

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

10 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

夷施例4 (56)

3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

15 フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン殿

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)⁺•

20

夷脑例4 (57)

3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H) $^{+}$.

爽施例4 (58)

3- (N- ((2- (2- ((4-メトキツベンジルアミノ) カルボニル)

S フェニル) フェニル) カルポニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシフェ

コル) エチル) アミノ) プロパン感

HPLC遊院条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

5

夹施例4 (59)

3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシフェニ ツ) ェチツ) アミノ) プロパン酸

5 HPLC测定条件:A

HPLC保控時間:3.88分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

夷施例4 (60)

20 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシ 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC阅定条件:A

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.82分;

MASS $\vec{\tau} - \beta$ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)⁺.

79

25

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

奥施例4 (61)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,3-ジメトキシ 3- (N- ((2- (2- ((N-エチルーN-ベンジルアミノ) カルボコ フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H) $^{+}$.

夷施例4 (62)

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシ 3- (N- ((2- (2- ((N-プチルーNーペンジルアミノ) カルボニ フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 HPLC保持時間:4.08分; HPLC測定条件:A

5 MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M + H) $^+$.

実施例4 (63)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-(2,3-ジメトキシ 3- (N- ((2- (2- ((4- (lent-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

20 フェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.11分;

MASSF-4 (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)+.

23 **與施例4 (64)**

3- (N- ((2- (2- (((5-メチル-2-フリル) メチルアミノ)

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)[†]。

|植例4 (65)

3-(N-((2-(2-((1-フェニル-3-トリフルオロアセトキシ プロピルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2

10 - (2, 3ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:4.05分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 707 (M+H)⁺.

15 実施例4 (66)

3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間:3.80分;

7 (101 To 1011) 1 505 (A

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+.

爽施例4 (67)

3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

25 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン殴

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+.

- 実施例4 (68)

3- (N- ((2-(2-(2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

10 HPLC保持時間: 3.84分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)+

奥施例4 (69)

3- (N- ((2- (2- (((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

15 チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

20

夷范例4 (70)

3- (N- ((2- (2- ((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

8

∞

 $MASS\vec{7}-9$ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)⁺.

3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシフェ

リア) エチア) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASS F-9 (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+

5

夹施例4 (72)

ニル) カルボニル) ーNー(2-(2,3-ジメトキシフェニル) エチル) 3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

アミノ) プロパン酸

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 517 (M+H)+.

20 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 3-ジメトキ 3- (N- ((2- (2- ((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

HPLC浏定条件:A

シフェニア) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)+.

25

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

<u> 実施例4(74)</u>

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 3ージメトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ ァ) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H).

夷施例4 (75)

5 チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ HPLC测定条件:A HPLC保持時間: 3.62分; (2, 3ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

夷施例4 (76)

2

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H).

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2,

3ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

20

HPLC保持時間: 3.93分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

25 **夷施例4 (77)**

3- (N- ((2- (2- ((1- (4ーフルオロフェニル) エチルアミノ)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 3-ジ

メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)+

S

夷施例4 (78)

3- (N- ((2- (2- ((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 3-ジメトキシフェニ

5 ラ) エチラ) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.75分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H).

2

3、4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2- (2- (((3S) -3-ヒドロキンメチル-1, 2, ェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシフェニル)エチル)

20 HPLC测定条件:A

アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.67分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H) $^+$.

**夷
施
例 4 (8 0)**

25 エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,3-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

8

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ラ) メチラ) アミノ) プロペン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+。

実施例4 (81)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,3-ジメトキ シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2-(2-('(3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 HPLC適烷条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)+,

英施例4 (82)

5 N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 596 (M+H)+,

20

夷施例4 (83)

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

-N-(2-(2, 3-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン殹

HPLC測定条件: A

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.45分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 638 (M+H)+.

夷施例4(84)

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,3-ジメトキシフェニ ラ) エチラ) アベノ) プロパン感

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

10 MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

奥施例4 (85)

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (ビ 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ

2 リジンー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC遊院條件: A

HPLC保持時間:3.22分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 548 (M+H).

20 夷施例4 (86)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (ピ 3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)

リジンー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC酒定条件:A

HPLC保持時間: 3.03分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)+.

87

PCT/JP03/06678

寒肺例4 (87)

ニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ビリジン-3-イル)エチル) 3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.00分;

MASS F-9 (ESI, Pos., 20V) : 498 (M+H)+.

夷施例4 (88)

フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミ 3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

ノ) ノロバン酸

HPLC测烷条件:A

2 HPLC保持時間: 3.18分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H) $^+$.

奥施例4 (89)

3ー(N-((2-(2-((1-ナフチルメチルアミノ)カルボニル)フ

20 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (ピリジン-3ーイル) エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.25分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 558 (M+H) $^{+}$.

25

奥施例4 (90)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル) 3- (N- ((2-(2-((ビリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:2.72分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)+, 255

寒施例4 (9.1)

3- (N- ((2-(2-(ビリジン-3-イルメチルアミノ)カルボニ

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC浏定条件:A

HPLC保持時間:2.68分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)+, 255.

<u> 夷施例4 (92)</u>

2

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3 - (N - ((2 - (2 - ((1, 2, 3, 4 - テトラヒドロインキノリン

20 HPLC遡定条件:A

(アリジンー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)+.

夷施例4 (93)

25 3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル)エチ

89

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ア) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+.

実施例4 (94)

3- (N- ((2- (2- (ペンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ ェニル) カルボニル) ーNー(2-(ピリジンー3-イル)エチル)アミノ)

5 HPLC測定条件:A

アロスン酸

HPLC保持時間:3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)+

爽施例4 (95)

5 チル) アミノ) プロパン酸 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-3-イル)エ 3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.12分;

20 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H).

夷施例4 (96)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル)エチ 3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 ア) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+.

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル)エチ 3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ ル) アミノ) ノロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.22分;

5 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)+.

夷施例4 (98)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル)エ 3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

5 チラ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.09分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+.

20

3- (N- ((2- (2- ((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル)エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

25

91

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H) $^{+}$.

夷施例4 (100)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル) 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)*

10 実施例4 (101)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル) 3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC測定条件:A

エチル) アミノ) プロパン酸

2 HPLC保持時間: 3.25分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)⁺.

夷施例4 (102)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

20 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル)

エチル)アミノ)プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.40分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)⁺.

25

夷施例4 (103)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル) 3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - (ten-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.38分;

S

MASS $\vec{\tau} - \mathcal{F}$ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)⁺.

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (ピリジン-3-イル) エ 3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

チル) アペノ) プロパン酸

5

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.12分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H) †

夷施例4 (105)

5

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イ 3 - (N - ((2 - (2 - ((2, 5 - ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ア) エチア) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.14分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H) $^+$.

寒梔例4 (106)

25 チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3 - (N - ((2 - (2 - (((1R) -1 -フェニルー2 - ヒドロキシエ

ಜ

WO 03/099765

PCT/.IP03/06678

(ピリジンー3ーイル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.00分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+.

実施例4 (107)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ヒリジン-3-イル)エチ 3- (N- ((2- (2- ((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)+.

実施例4 (108)

ᅜ 3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル)エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.11分;

20 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H).

寒施例4 (109)

ニル) カルボニル) ーN~(2-(ヒリジン-3-イル)エチル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

25 アロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:2.92分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 458 (M+H)+.

奥施例4 (110)

3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフトオロベンジトアミノ) カルボ ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-3-イ

HPLC遊院条件:A

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.11分;

5 MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)+,

奥施例4 (111)

ェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチ 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

2 万) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件: A

HPLC保持時間:3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)+

20 夷施例4 (112)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-3- (N- ((2- (2- (((1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

HPLC测定条件:A

(アリジンー3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 2.98分;

25

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H) $^{+}$.

8

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

<u> 実施例4 (113)</u>

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (ピ 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-(4-メチルフェニル) エチ

リジンー3ーイブ) エチブ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)+,

5 実施例4 (114)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) 3ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

2 HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 540 (M+H)+

<u> 実施例4(115)</u>

3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) INI (2- (ピリジン-3-イル) エチ

ル) アミノ) プロパン酸

20

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.07分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 514 (M+H)+.

25

実施例4 (1.16)

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2-(2-(((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, レロスン製 ェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) 3、4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

S HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.07分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H) $^+$, 283.

ಠ 3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2-(ピリジン-3-イル)エチ

HPLC测定条件:A

ア) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.18分;

2 MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

夹施例4 (118)

3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジファオロベンジァアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-3-イ

20 ラ) イチラ) アミノ) プロバン製

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)+

25

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルビリジン-2

ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

NI(2-(ピリジン-3-イル) エチパ)アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 2.74分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+, 432, 269,

実施例4 (120)

3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルブミノ) エチ ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

-N-(2-(ヒリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC测定条件:A

5

HPLC保持時間: 2.92分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)+, 290, 267.

2 **奥施例4 (121)**

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-3-イル)エチ 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

ラ) アミノ) プロスン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.16分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+.

寒施例4 (122)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ

25 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (4 ーメチルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)+.

夹施例4 (123)

S

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4 3- (N-(·(2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル) ーメチルフェニル) エチグ) アミノ) プロバン感

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間:3.77分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+.

3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルポニル) フェニル)

2 フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミ

ノ) ノロベン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

20

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルポニル) フ

ル) アミノ) プロパン酸

25

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチ

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H).

夷施例4 (125)

HPLC阅定条件: A

HPLC保持時間:4.08分;

PCT/JP03/06678

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H).

実施例4 (126)

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.33分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

5

夷施例4 (127)

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)

エチル)アミノ)プロパン酸

15 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.27分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+.

寒施例4 (128)

8 ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリン (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)⁺。

PC1/JP03/06678

ラ) アペノ) プロパン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーメチルフェニル) エチ 3 - (N - ((2 - (2 - ((αーメチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC阅定条件:A

S

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)⁺。

夷施例4 (130)

5 3- (N- ((2- (2- ((ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ ェニル) カルポニル) ーNー (2ー (4ーメチルフェニル) エチル) アミノ)

HPLC測定条件:A

プロバン製

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)+。

5

実施例4 (131)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)エ 3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

チル) アミノ) プロパン数

20

HPLC遊定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

25 夷施例4 (132)

3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

VO 03/099765

PC17JP03/06678

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチ

ア) アミノ) プロパン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.00分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

寒施例4 (133)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-メチルフェニル)エ 3- (N- ((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

5 チル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)⁺。

15 実施例4 (134)

ブ) アミノ) プロパン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)エチ 3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間:4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+。

3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

25 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)エ チル) アミノ) プロペン酸

<u>0</u>

PC1/JP03/06678

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

S 奥施例4 (136)

ュニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチ 3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ア) アペノ) プロバン酸

HPLC浏定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)⁺•

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

7 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

20

夹施例4 (138)

3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-(6-メチルピリジン-2 ーイル)メチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)ー

N-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミノ)プロバン酸

HPLC密定条件:A

25

HPLC保持時間: 3.34分;

NO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+.

実施例4 (139)

3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)

エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

5

夷施例4 (140)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

2 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.21分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+

実施例4 (141)

20 3- (N- ((2-(2-((4-(ten-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)

エチラ) アミノ) プロパン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.22分;

25 MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+

104

<u></u>

寒施例4 (142)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (4-メチル 3- (N- ((2-(2-(((5-メチル-2-フリル) メチルアミノ)

HPLC測定条件:A

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

S

HPLC保持時間:3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)+.

5 プロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2 3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-トリフルオロアセトキシ (4ーメチルフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.16分;

15 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 661 (M+H)+.

フェニル) フェニル) カルポニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)エ 3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

20 チラ) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+

25 喪施例4 (145)

3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-メチルフェニル)エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+

実施例4 (146)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-メチルフェニ 3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 ア) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)⁺

5 **寒施例4 (147)**

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

(4ーメチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.77分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

<u> 実施例4 (148)</u>

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニル)エチ

ア) アペノ) プロパン酸

5

WO 03/099765

PC1/JP03/06678

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+.

夷施例4 (149)

3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)⁺。

爽施例4 (150)

3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

5 ニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーメチルフェニル) エチル) アミノ)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.75分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 471 (M+H)+

夷施例4 (151)

20

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニ 3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジファオロベンジァアミノ) カアボ

ア) エチア) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

25

HPLC保持時間:3.89分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+.

実施例4 (152)

3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-メチルフェニル)エチ

ラ) アペノ) プロパン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+.

5

爽施例4 (153)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニルー2-ヒドロキシエ (4ーメチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC测定条件:A

HPLC保控時間: 3.75分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H).

実施例4 (154)

20 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ ーメチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+。

25

108

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-メチル 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) 実施例4 (155)

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:4.02分;

S

HPLC測定条件:A

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H) $^{+}$.

爽施例4 (156)

5 3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーメチルフェニル) エチ

HPLC測定条件:A

ル) アミノ) プロバン酸

HPLC保持時間:3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)⁺。

5

3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

20 ェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーメチルフェニル) エチル) アミノ)

レロスン母

HPLC测定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+

夹施例4 (158)

25

9

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ア) アミノ) プロパン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーメチルフェニル) エチ 3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

実施例4 (159)

3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メチルフェニ

ツ) エチル) アミノ) プロパン酸

5

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

2

実施例4 (160)

N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.33分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)+

実施例4 (161)

ટ ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

ーNー (2ー (4ーメチルフェニル)エチル)アミノ) プロパン酸

HPI.C浏定条件:A

HPLC保持時間:3.55分;

MASS $\vec{7}-\vec{9}$ (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)⁺

與施例4 (162)

ラ) アペノ) プロパン製 ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチ 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルポニル) フ

5 HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASS=-> (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

夹施例4 (163)

2 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3 3-(N+((2-(2-((1. 2. 3. 4-7.75 + F-1-1-77 + 2. 3. 4-7.75 + F-1-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4. 3. 4-7.75 + 2. 3. 4. 3ーメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+.

夷施例4 (164)

25 ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3 3- (N- ((2- (2- ((N-ペンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.66分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

寒施例4 (165)

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニル) エ 3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

5 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H).

実施例4 (166)

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((a-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

2 チァ) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+.

20 奥施例4 (167)

エニル) フェニル) カルボニル) ~N~(2~(3~メトキシフェニル)エ 3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

チッ)アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

ટ્ટ HPLC保持時間:3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+.

112

Ξ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-メトキシフェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

S チル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)⁺.

ö **爽施例4 (169)**

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニル) 3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - メトキツベンジルアミノ) カルボニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

2 HPLC保持時間:3.77分;

MASS=-> (ES], Pos., 20V) : 567 (M+H).

夷施例4 (170)

3- (N- ((2- (2- ((N- (イソプロピル) -N-ベンジルアミノ)

20 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキ

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)⁺, 571。

25

113

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニ ル) エチル) アミノ) プロバン酸 3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+,

実施例4 (172)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチルーN-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニ

ル) エチル) アミノ) プロバン酸

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASS $\overrightarrow{\neg} - \cancel{\nearrow}$ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H) $^{+}$.

2

夹施例4 (173)

3- (N- ((2- (2- ((4- (tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシフェニ

ハ) エチハ) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.11分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)

実施例4 (174)

25 3- (N- ((2- (2- (((5-メチル-2-フリル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキ

HPLC测定条件:A

東施例4 (175)

S

3- (N- ((2-(2-((1-フェニル-3-トリフルオロアセトキシ

(3ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5

MASS= - % (ESI, Pos., 20V) : 699 (M + Na)+, 677 (M + H)⁺.

2 3- (N- ((2- (2- ((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

20

3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

(3ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

15

シフェール) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+。

プロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.04分;

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェ

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)+。

夹施例4 (177)

チルアミ /) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-

25

HPLC测定条件:A

WO 03/099765

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

寒施例4 (178)

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

チル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+

実施例4 (179)

3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル)

2 エチル) アミノ) プロベン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+.

8

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC避定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+.

1

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

夷施例4 (181)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-3 - (N - ((2 - (2 - (((1S) - 1 - フェニルー 2 - ヒドロキシエ

(3ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン樹

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

5

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3 ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 3-(N-((2-(2-(((1R)-1-(4-11112-11112))15)17))15)

HPLC資烷条件:A

2 HPLC保持時間: 3.95分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

夷施例4 (183)

3- (N- ((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

20 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-メトキ

シフェニル) エチラ)アペノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

25

HPLC保持時間: 3.89分;

寒施例4 (184)

MASS $\mathcal{F}-\mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)⁺.

117

3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N-((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, ェニル) カルポニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミ ノ)
レロ
バン
や

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+,

5 3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ チル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニル) エ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

15 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

実施例4 (186)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェ 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

8 コル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)⁺。

25 寒焔例4 (187)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2

PC1/JP03/06678

ーイル)メチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)ー

N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 566 (M+H)+

Ņ

喪施例4 (188)

ル)-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル) (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

5 -N-(2-(3-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.45分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 608 (M+H)+

2

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーメトキシフェニル) エ 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

チル)アペノ)プロペン酸

HPI.C测定条件:A

20 HPLC保持時間:3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

與施例4 (190)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ

25 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2

ーチエニル) エチル) アミノ) プロバン酸

119

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)+,

奥施例4 (191)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2 3- (N- ((2- (2- ((Nーベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)

ーチェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.62分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 557 (M + H).

寒焔例4 (192)

3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルポニル) フェ

2 ニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-チエニル)エチル)アミ

ノ) ノロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 503 (M+H)+,

20

寒施例4 (193)

3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル)エチル)アミノ)ブ

ロスン概

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

VAO 03/099765

PC17/JP03/06678

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H) $^+$

夹施例4 (194)

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

Ş ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーチエニル) エチル) ア

ハノ)ノロバン数

HPLC阅烷条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)+,

寒施例4 (195)

5

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チェニル) エチ

ア) アペノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

15

HPLC保持時間: 3.22分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 514 (M+H)+

実施例4 (196)

20 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーチエニル) エチ

ラ) アペノ) アロバン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.14分;

25

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 514 (M+H)+

寒施例4 (197)

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン

(2ーチェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+.

夷施例4 (198)

6 3- (N- ((2-(2-((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーチエニル) エチル) ア

ハノ) アロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

2 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)⁺。

奥施例4 (199)

3- (N- ((2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ ェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル) アミノ) プロ

20 よソ環

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.79分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 513 (M+H)+。

25 **奥施例4 (200)**

3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーチエニル) エチル)

アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+

夷施例4 (201)

3- (N- ((2-(2-((2-メチルペンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-チエニル) エチル) ア

5 ミノ) アロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+

5 **爽施例4 (202)**

3- (N- ((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (2-チェニル) エチル)

アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+,

夷施例4 (203)

3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル) ア

ハノ) ノロバン酸

WO 03/099765

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H).

寒늂例4 (204)

3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-チエニル)エチル)

アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+

実施例4 (205)

3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル) ア

ハノ) ノロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+

20

実施例4 (206)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-チエニル) エチ 3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ラ) アミノ) プロパン酸

25 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分;

!

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+

契施例4 (207)

3- (N- ((2- (2- ((N- (イソプロピル) -N-ベンジルアミノ)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニ

ハ) ドチハ) アミノ) プロパン製

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)⁺.

爽施例4 (208)

5

3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-チェニル)エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

5

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+,

夷施例4 (209)

20 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチ 3- (N- ((2- (2- ((N-プチルーN-ベンジルアミノ) カルボニ

ラ) アペノ) プロペン母

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)+

ટ

WO 03/099765

PC17/JP03/06678

実施例4 (210)

3- (N- ((2-(2-((4-(tert-プチル) ベンジルアミノ) カルポニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2-チエニル) エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H) $^{+}$

実施例4 (211)

5 3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-チ

エニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.60分;

2 MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

実施例4 (212)

3- (N- ((2- (2- ((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル)

20 アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASS = (ESI, Pos.; 20V) : 531 (M+H)

23 **奥施例4 (213)**

3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル)エチル)

アペノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 531 (M+H)+

寒施例4 (214)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2-チェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 チブ) アミノ) プロバン酸

HPLC保持時間:3.82分;

HPLC测定条件:A

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

5 **契施例4 (215)**

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ (2ーチエニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間:3.60分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+

爽施例4 (216)

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーチェニル) エチル) ア

ミノ) プロパン酸

WO 03/099765

HPLC保持時間:3.16分;

HPLC测定条件:A

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 542 (M + H)⁺,

寒施例4 (217)

アミノ) プロバン酸 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル)エチル) 3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 531 (M+H)+, 156

夷姉例4 (218)

3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

5 ニル) カルボニル) ーNー(2ー(2ーチエニル) エチル) アミノ) プロパ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 463 (M+H)⁺。

20

実施例4 (219)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エ 3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

25

HPLC保持時間:3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+。

夷施例4 (220)

3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

S ェニル) フェニル) カルポニル) ーN-(2-(2-チエニル) エチル) ア

ハノ) ノロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+

70

3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-

(2-チェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

5

HPLC保持時間: 3.62分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+,

夷施例4 (222)

20 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2 3-(N-((2-(2-(((1R)-1-(4-197)71=14))15))15)

ーチエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.93分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+

129

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

契施例4 (223)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニ 3- (N-'((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

HPLC測定条件:A

ラ) エチラ) アミノ) プロパン数

HPLC保持時間:3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 545 (M+H)+

寒施例4 (224)

5 ハノ)プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーチエニル) エチル) ア 3- (N- ((2- (2- ((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

ᅜ MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 519 (M+H)+

実施例4 (225)

3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

20 ェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーチエニル) エチル) アミノ) プロ

よソ思

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.63分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)+.

25

実施例4 (226)

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) ア

ミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+

夷施例4 (227)

(N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チェニル)エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC逆烷条件:A

5

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

夷旆例4 (228)

15

3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-(6-メチルピリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

NI(2-(2-チエニル)エチル)アミノ)プロパン徴

HPLC测定条件: A

20

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)+

喪施例4 (229)

25

ル) -N-ペンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N. Nージメチルアミノ) エチ

ーN-(2-(2-チエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.44分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 584 (M+H)+

実施例4 (230)

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーチエニル) エチル) ア

ハノ) レロバン数

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASS → (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+

夷施例4 (231)

ᅜ ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(ピリジ 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ ソー3ーイ끼メチル) アベノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

20 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)+.

<u> 実施例4 (232)</u>

3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ピリジン

ー3ーイアメチル) アミノ) プロパン酸

23

HPLC测定条件:A

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.07分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H).

東施例4 (233)

3- (N- ((2- (2- ((1ーナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ピリジン-3-イルメチル)アミ ノ)
レロ
よ
ソ
酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.25分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)⁺。

爽施例4 (234)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) 3- (N- ((2-(2-((ビリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

アミノ) プロパン酸

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 2.70分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 989 (2M+H)⁺, 495 (M+H)⁺, 248,

8 **夷施例4 (235)**

ル) フェニル) フェニル) カルポニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) 3- (N- ((2-(2-((ビリジン-4-イルメチルアミノ) カルボニ

アハノ) プロパン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 2.70分;

25

133

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 989 (2M+H)⁺, 495 (M+H)⁺, 248.

実施例4 (236)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメデル) アミ 3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ノ) アロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.16分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H) $^{+}$.

5 **爽施例4 (237)**

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ピリジンー3ーイルメチル) アミ 3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルポニル) フ

ノ) ルロスソ 要

HPLC测定条件:A

2 HPLC保持時間: 3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)⁺•

夷施例4 (238)

3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

20 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ピリジンー3-イルメチル) アミ

ノ) プロパン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASS 7-4 (ESI, Pos., 20V) : 528 (M+H)+

23

奥施例4 (239)

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

アハノ) ノロバン数 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ピリジン-3-イルメチル) 3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC選点条件:A

HPLC保持時間: 3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : S22 (M+H)+

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) 3- (N- ((2-(2-((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

5

HPLC保持時間: 3.42分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)+

爽施例4 (241)

15

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (ピリジン-3-イルメチル) 3- (N- ((2-(2-((4-(ten-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

20 HPLC测定条件:A

アミノ) プロパン母

HPLC保持時間: 3.42分;

MASSF-> (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)+

25

3- (N- ((2-(2-((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ピリジン-3

135

ーイラメチラ)アッノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.01分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+

実施例4 (243)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ピリジンー3ーイルメチ 3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ラ) アッノ) アロバン製

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 530 (M+H)⁺。

2 **チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ピリ** 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ ジソー3ーイアメチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)+

20

実施例4 (245)

ュニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ビリジンー3ーイルメチル) アミ 3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 ノ) アロバン酸

HPLC遡烷条件:A

PCT/JP0J/06678

WO 03/099765

PC37JP03/06678

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 528 (M+H)+

3- (N- ((2- (2- ((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ピリジンー3ーイルメチル) アミ

ノ) アロバン殴

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

5 MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 528 (M+H)+

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリ 3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

ジンー3ーイバメチジ)アミノ)プロバン製

2

HPLC阅点条件:A

HPLC保持時間:3.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)+

8

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ピリジ 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

ソー3ーイラメチラ)アハノ)プロパン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.23分;

25

137

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+,

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNI (ピリジンー3ーイ 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) 寒施例4 (249)

ラメチラ) アベノ) プロパン駅

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H) $^+$.

5 実施例4 (250)

ェニル) カルボニル) ーNー (ビリジンー3ーイルメテル) アミノ) プロパ 3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4ーテトラヒドロイソキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

21 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.09分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)+

実施例4 (251)

20 3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルポニル) フ ノ)ノロバン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (ピリジン-3-イルメチル) アミ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.17分;

25 MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)+.

/06678

3- (N- ((2-(2-(3,5-ジフルギロベンジルアミノ) カアボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ピリジンー3-イルメチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

S

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 530 (M+H)+.

夷施例4 (253)

10 3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-(6-メチルピリジン-2-イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ピリジン-3-イルメチル) アミノ) プロパン樹

HPLC测定条件: A HPLC保持時間: 2.76分;

15 MASS $\vec{\tau} - \vec{\rho}$ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)⁺, 262.

爽施例4 (254)

3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

20 -N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 2.94分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)⁺, 283.

25 実施例4 (255)

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(ピリジン-3-イルメチル)アミ

ノ) レロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

5 MASS $\vec{\tau} - \theta$ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)⁺.

実施例4 (256)

3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フ

10 ェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)+。

15 実施例4 (257)

3- (N- ((2-(2-()N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロビル)アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

実施例4 (258)

3- (N- ((2- (2- ((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

ニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルプロピル) アミノ) ブ

ロスン

25

VO 03/099765

PC17J1303/06678

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

夷施例4 (259)

フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン 3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)⁺,

夷施例4 (260)

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

5 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ーフェニルプロピル) アミノ)

プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H) $^{+}$.

夷施例4 (261)

20

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) ア

ハノ) アロバン母

HIPLC遺烷条件: A

HPLC保持時間: 3.29分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 511 (M+H)+

3 - (N - ((2 - (2 - (ピリジンー3ーイルメチルアミノ) カルボニ

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2-フェニルプロピル) ア

ミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

5

夷施例4 (263)

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリン

フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

15 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+

実施例4 (264)

20 3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ)

レロベン概

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

25 MASS F-> (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+.

夷施例4 (265)

3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ)

レロ パン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

寒施例4 (266)

5 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

5

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルプロピル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

20 アロベン思

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)[†]

ટ્ટ

夷施例4 (268)

3 ー (N ー ((2 ー (2 ー ((4 ークロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルプロピル)アミノ)

レロスン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.01分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H).

<u> 東施例4 (269)</u>

3- (N- ((2- (2- ((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ)

ノロスソ概

0

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)*

15 <u> 実施例4(270)</u>

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2ーフェニルプロピル) アミノ) 3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

アロベン製

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間:3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)⁺,

実施例4 (271)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル)ア

ミノ) プロパン酸

25

144

PCT/JP0J/06678

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

S **爽施例4 (272)**

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル)ア 3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ペンジルアミノ) カルボニ

ハノ) ノロバン酸

HPLC测定条件:A

70 HPLC保持時間:4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+。

夹施例4 (273)

3- (N- ((2-(2-((N-プチル-N-ペンジルアミノ) カルボニ

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルプロピル)ア

ハノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.19分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+

20

夷施例4 (274)

3 — (N — ((2 — (2 — ((4 — (ten-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル)ア

ハノ) ノロスソ殴

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.22分;

25

145

MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+.

3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-トリフルオロアセトキシ

プロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2

ーフェニハプロアル) アミノ) プロパン感

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.13分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 661 (M+H)+。

5

実施例4 (276)

3- (N- ((2- (2- ((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+,

実施例4 (277)

8 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

レロベン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+

PCT/JP03/06678

夷施例4 (278)

ニル) フェニル) フェニル) カルポニル) ーNー (2ーフェニルプロピル) 3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

アハノ) プロバン母

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+.

班施例4 (279)

5 チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ フェニハプロマハ) アミノ) プロパン感

HPLC迥定条件:A

HPLC保持時間: 3.71分;

2 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)⁺。

夷施例4 (280)

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ)

8 ルロベン概

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+

25 **夷施例4 (281)**

3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ)

ルロベン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H) $^+$

実施例4 (282)

ニル) カルボニル) ーNー(2-フェニルプロピル)アミノ)プロバン殴 3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 471 (M+H)+

実施例4 (283)

15 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルプロピル) 3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

アハノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

寒施例4 (284)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル)アミノ) 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルポニル) フ

25 プロスツ要

HPLC測定条件:A

PCT/JP0J/06678

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:4.00分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+.

実施例4 (285)

S 3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸 チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2-

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

5

夷施例4 (286)

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フ 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

ェリラノロアラ) アッノ) ノロバン製

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

20

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ーフェニルブロ 3- (N- ((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

アラ) アハノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.97分;

149

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H).

寒施例4 (288)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

プロペン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+.

5 寒焔例4 (289)

ェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸 3, 4ーテトラヒドロイソキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2-(2-(((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2.

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間:3.58分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+;

HPLC保持時間:3.75分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+, 473,

20 **東施例4 (290)**

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルプロピル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

アロベン酸

HPLC阅定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.97分;

MASS $\overrightarrow{7}$ - $\cancel{9}$ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H) $^{+}$.

PCT/JP03/06678

奥施例4 (291)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル)

アミノ) ノロバン酸

S

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H).

爽施例4 (292)

5

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2 NI (2-フェニルプロピル) アミノ) プロバン酸 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

HPLC適点条件:A

HPLC保持時間: 3.29分;

2

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)+.

爽施例4 (293)

3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, Nージメチルアミノ) エチ

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

ーNー(2-フェニルプロピル)アミノ)プロバン酸

20

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.51分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)+

寒施例4 (294)

25

3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

プロペン数

ェニル) フェニル) カルボニル) --N- (2-フェニルプロピル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+,

実施例4 (295)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4ーテトラヒドロ-1-ナフチ

5 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピ リジソー2ーイバ)エチバ)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 548 (M+H)+。

15

夷施例4 (296)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (ピ 3- (N- ((2-(2-()N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル) リジンー2ーイル)エチル)アミノ)プロバン酸

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.07分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)+

夷施例4 (297)

25 ェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (ピリジン-2-イル) エチ 3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

152

PCT/JP03/06678

アンアルノ) アロスン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.27分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 558 (M+H)+

裏施例4 (298)

3- (N- ((2-(2-((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-2-イル)エチ

ル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

奥施例4 (299)

2 3- (N- ((2-(2-((2-メチルペンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (ピリジンー2ーイル) エチ

ラ) アミノ) プロペン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.18分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

実施例4 (300)

3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ア) アミノ) プロペン数

25

ェニル) フェール) カルボニル) ーNー (2- (Lリジン-2-イル) エア

HPLC短定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)+

夷施例4 (301)

3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-2-イル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.29分;

5 MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)+

夷施例4 (302)

3- (N- ((2-(2-((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-2-イル)

5 エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.45分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+

20 寒施例4 (303)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-2-イル) 3- (N- ((2-(2-((4-(tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.42分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+

154

3- (N- ((2- (2- (((5-メチル-2-フリル) メチルアミノ)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-

2ーイル) エチル) アミノ) プロバン酸

S

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.11分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H) $^{+}$.

爽施例4 (305)

5

3- (N- ((2-(2-((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (ピリジ

ソー2ーイル) エチル) アミノ) プロパン感

HPLC遊院条件:A

HPLC保持時間:3.01分;

2

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)+

夹施例4 (306)

3- (N- ((2- (2- ((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

20 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (ピリジンー2ー4

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)*

25

夹施例4 (307)

VVO 03/099765

PCT/JP03/06678

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ (アリジン-2-イラ) エチラ) アミノ) プロパン感

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.00分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+

実施例4 (308)

3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル)・フ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (ピリジンー2ーイル) エチ

ル) アミノ) プロパン酸

-0

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)+

5

実施例4 (309)

3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-

(ピリジンー2ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.01分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+,

実施例4 (310)

25 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2-(ピ 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

PCT/JP03/06678

リジソー2ーイラ) エチラ) アミノ) プロバン酸

HPLC適定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)+

夷施例4 (311)

3- (N- ((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-

2ーイル) エデア) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

70

HPLC保持時間: 3.20分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 540 (M+H)+

5 3- (N-((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2,

3、4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

ュニル) カルボニル) ーNー (2ー (ピリジンー2ーイル) エチル) アミノ)

HPLC测定条件:A

プロスン母

HPLC保持時間: 2.96分;

20

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+, 282;

HPLC保持時間:3.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+

23 爽施例4 (313)

3 - (N - ((2 - (2 - (3 - メ テ / ハ / ソ ジ / ア * ノ) カ / ボ - イ / フ) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ビリジン-2-イル)エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

<u> 実施例4(314)</u>

3- (N- ((2- (2- ((N-メチルーN- (6-メチルビリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

NI(2-(ピリジンー2-イル) エチル)アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

5

HPLC保持時間:2.74分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+, 432, 269,

2 **夷施例4 (315)**

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ -N-(2-(ピリジン-2-イバ) エチル) アミノ) プロパン樹

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間:2.92分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)+, 290, 267.

実施例4 (316)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ

25 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3,

4ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

PCT/JP0J/06678

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+

夷施例4 (317)

S

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)

4ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC阅烷条件:A

5 HPLC保持時間:3.49分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+,

3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

5 ニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 4-ジメトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC运汽条件: A

HPLC保持時間:3.55分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)⁺。

25

HPLC保持時間: 3.73分;

20

3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

爽施例4 (3 1 9)

フェニル) カルボニル) ーNー (2-(3,4-ジメトキシフェニル) エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+.

実施例4 (320)

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3, 4-ジメトキシフェニ

ハ) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)+

5

寒施例4 (321)

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 4ージメトキシ

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

15 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)+

奥施例4 (322)

20 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシ

フェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.07分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)+.

23

PCT/JP03/06678

夹施例4 (323)

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-デトラヒドロインキノリン

(3, 4ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

Ş

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+, 358.

夷肺例4 (324)

5 ラ) メチラ) アベノ) プロパン類 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-(3, 4-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

2 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

3- (N- (´(2- (2- (ペンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ エニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニル) エチル)

アミノ) プロペン酸

20

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

夹施例4 (326)

25

3- (N-((2-(2-((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.71分;

<u> 実施例4 (327)</u>

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.66分;

コラ) エチル) アミノ) プロパン酸

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 4ージメトキシフェ

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3, 4-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 ル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

5 **爽施例4 (328)**

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェ ニル) エチル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.66分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

奥施例4 (329)

3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

23 エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3, 4-ジメトキシフェニ

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+, 346。

夷施例4 (333)

HPLC密定条件:A

HPLC保持時間: 3.79分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)+

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 4-ジメトキシフェ 3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシ

3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

フェニル) エチル) アミノ) プロバン製

3- (N- ((2-(2-((4-メチァベンジァアミノ) カァ共ニル) フ

ร ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 4-ジメトキシフェニ

HPLC測定条件:A

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

- 爽施例4 (332)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3,4-ジメトキシ

25

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

20

3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC保持時間:3.67分;

5 HPLC保持時間: 3.62分; 奥施例4 (330) HPLC测定条件:A ール) エチァ) アミノ) プロパン窓 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+.

夷施例4 (334)

<u>~</u>

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H) $^+$, 360.

HPLC保持時間:3.77分; HPLC測定条件:A

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (3,4-ジメトキシ 3-·(N-((2-(2-()N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

5 HPLC適定条件:A

HPLC保持時間:3.97分;

MASS $\vec{\tau}$ - \not (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)⁺, 388.

20 3- (N- ((2-(2-((4-(ten-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3,4-ジメトキシ

HPLC測定条件:A フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.99分;

MASS $\vec{\tau}$ — $\not>$ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H) $^+$, 388 $_\circ$

25

PCT/JT03/06678

夷施例4 (336)

ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 4

HPLC测定条件:A

S

爽施例4 (337)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3,4-ジメトキシフェ リラ) エチラ) アペノ) プロパン酸 3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC保持時間: 3.67分;

爽施例4 (338)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 4ージメトキシフェ 3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

20 リル) エチル) アミノ) プロパン母

HPLC測定条件:A

25

3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

3-(N-((2-(2-((1-フェニルー<math>3-ヒドロキシプロピルアミ

HPLC保持時間:3.47分;

MASS $\vec{7}-\vec{9}$ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)⁺.

5

HPLC測定条件:A

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)*

HPLC保持時間:3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキ シフェニル) エチア) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.69分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H) $^{+}$.

夷施例4 (340)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-((((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

(3, 4ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.49分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

5 奥施例4 (341)

ル) エチル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3,4-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)+

実施例4 (342)

3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

25 フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2-(3,4ージメトキシフェ

ニル) エチル) アミノ) プロパン母

PCT/JP03/06678

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+

奥施例4 (343)

ニル) カルポニル) ーNー (2ー (3, 4ージメトキシフェニル) エチル) 3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.47分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 517 (M+H)+

<u> 実施例4 (344)</u>

3- (N- ((2-(2-((2,6-ジフルオロベンジルアミノ)カルボ

2 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 4ージメトキ

シフェニア) エチア) アミノ) プロパン感

HPLC测定条件:A

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)+

HPLC保持時間: 3.66分;

夷施例4 (345)

20

3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルポニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニ

HPLC斑烷条件:A

25

HPLC保持時間: 3.79分;

ブ) メチブ) アペノ) プロバン製

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)+,

実施例4 (346)

3- (N- ((2-(2-(((1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-

(3, 4ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.49分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+,

5

夷施例4 (347)

3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4ーメチルフェニル) エチ

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3,

4ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

寒施例4 (348)

20 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 4-ジ

メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC網定条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)+

25

168

PCT/JP03/06678

ハ) メチル) アペノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フ

S HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)+

夷施例4 (350)

5 アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, エニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 4ージメトキシフェニル) エチル) 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

HPLC测定条件:A

15 HPLC保持時間: 3.42分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)+, 388;

HPLC保持時間: 3.53分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)+, 519。

20

エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3, 4-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

グ) エチグ) アベノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.73分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+,

HPLC測定条件:A

69

実施例4 (352)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 4ージメトキ 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.75分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H).

6 実施例4 (353)

N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 596 (M+H)⁺。

夷姉例4 (354)

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

20 エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3,4-ジメトキシフェニ

ゾ) エチゾ) アペノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H).

25

夷施例4 (355)

000/8

3 - (N - ((2 - (2 - ((1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1 - ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N - (1 - メ

チルー3ーフェニルプロアル)アミノ)プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASST-9 (ESI, Pos., 20V) : 575 (M+H)+

寒施例4 (356)

3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)

10 アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)+.

12

寒施例4 (357)

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロビ

ラ) アミノ) プロベン母

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+.

典施例4 (358)

25

3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロビ

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

ラ) アペノ) プロパン類

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+,

.

実施例4 (359)

3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロビ

ア) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間:4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

実施例4 (360)

15 3- (N-((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニルプロビ

ア) アペノ) プロパン数

HPLC翘定条件:A

HPLC保持時間: 4.06分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)⁺。

夷施例4 (361)

3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (ピリジンー3ーイル) エ

25 チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+。

與施例4 (362)

プロアン)アミノ)プロバン酸 3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルブミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニル

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

10 · MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)+。

実施例4 (363)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニル 3- (N- ((2- (2- ((Nープチル-Nーベンジルアミノ) カルボニ

Ş プロアル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:4.26分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)+,

20 夹施例4 (364)

,ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニル 3- (N- ((2-(2-((4-(tertプチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ナロアラ) アミノ) ナロパン酸

HPLC测定条件:A

25

HPLC保持時間:4.22分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)+,

173

WO 03/099765

3- (N- ((2-(2-((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ 実施例4 (365) ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-

3ーフェニルプロピル) アミノ) プロパン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)⁺。

ಠ 與施例4 (366)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニルブロ 3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - フルオロベンジルアミノ) カルボニル) アア) アミノ) プロパン数

H.P.L.C测定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

5

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)+,

夷施例4 (367)

3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

20 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニ

ハプロペル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.99分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H).

25

PCT/JP03/06678

メチルー 3ーフェールプロピル)アミノ)プロバン樹 チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (1-3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

HPLC適烷条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+,

夷施例4 (369)

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

10 ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(1-メチル-3-フェニルプロピ ラ) アミノ) プロバン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)+,

奥施例4 (370)

5

ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(1-メチル-3-フェニルプロビ 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ラ) アミノ) プロパン数

20 HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)⁺•

25

3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (1ー

メチルー3ーフェニルプロピル) アミノ) プロパン殴

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

実施例4 (372)

チルー3ーフェニルプロピル) アミノ) プロバン酸 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (1ーメ 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-(4-メチルフェニル) エチ

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)+.

5 フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(1-メチル-3-3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

爽施例4 (374)

3, 4ーテトラヒドロイソキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2-(2-(((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,

25 レロスン製 ェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.69分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)+, 487,

夷施例4 (375)

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (1ーメチルー3ーフェニルプロビ 3- (N-((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 ラ)アハノ)プロスン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

5 夷施例4 (376)

ラプロパラ) アハノ) プロパン樹 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニ 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間:4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+

(N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

25 ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミノ)プロバン酸

WO 03/099765

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.60分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 606 (M+H)+。

夷施例4 (378)

ル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピ 3- (N- ((2-(2-((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

<u></u> HPLC保持時間:3.99分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+.

実施例4 (379)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ

2 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2 ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+.

20

実施例4 (380)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2 3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.67分;

PCT/JP0J/06678

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

実施例4 (381)

フェニル) カルボニル) ーNー(2-(2-メトキシフェニル)エチル)ア 3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

バノ) アロスツ母

S

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)+

夷施例4 (382)

5

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーメトキシフェニル) エ

チェ) アミノ) プロパン数

2 HPLC测定条件:A

IIP L C保持時間:4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+

夹施例4 (383)

20 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフェニ

ハ) エチア) アミノ) プロパン感

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.31分;

MASST-9 (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+

23

WO 03/099765

3- (N- ((2-(2-()ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフェニ

ブ) エチブ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+,

実施例4 (385)

5 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-

(2ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

5 MASSF-> (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)+

実施例4 (386)

3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフェニル) エ

20 **チラ)アペノ) プロパン数**

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+,

25 実施例4 (387)

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

PCT/JP03/06678

WO 03/099765

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフェニル) エ

ルラ) アミノ) プロスツ恩

HPLC資気条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

夷施例4 (388)

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーメトキシフェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 チル)アミノ)プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+

2 **夷施例4 (389)**

ラ) メチラ) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

寒施例4 (390)

3- (N- ((2-(2-((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

25 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2-メトキシフェニ

ル) エチル) アミノ) プロパン数

HPLC保持時間: 4.13分; HPLC测定条件:A

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)⁺。

実施例4 (391)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフェニ ル) エチル) アミノ) プロバン酸 3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - (tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間:4.17分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)

奥施例4 (392)

3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

5 ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メ トキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

20

夷施例4 (393)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2-メトキシフェ 3- (N- ((2- (2- ((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)+,

夷施例4 (3.94)

3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

S チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-

HPLC测定条件:A

(2ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン製

HPLC保持時間:3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

5

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

エコル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル) エ

チバ) アミノ) プロパン殴

2 HPLC測定条件:A

HPJ.C保持時間:3.97分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+

夷施例4 (396)

20 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (2-メトキシフェニル) 3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS $\vec{\tau}-\vec{p}$ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H) $^{+}$

25

PCT/JP03/06678

夷植例 4 (397)

ニラ) エチア) アミノ) プロパン酸 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェ 3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H).

実施例4 (398)

5 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ チル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーメトキシフェニル) エ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

15 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+

寒姉例4 (399)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

20 (2ーメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.69分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H).

25 **夷施例4 (400)**

3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4ーメチルフェニル) エチ

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2 ーメトキツフェニル) エチル) アミノ) プロパン数

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASST-9 (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

夷施例4 (401)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキ 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

ŏ シフェニア) エチア) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)+

2 **爽施例4 (402)**

チル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-(2-メトキシフェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間:3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+

奥施例4 (403)

3- (N- ((2-(2-(((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,

25 ュニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーメトキシフェニル) エチル) アミ 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

WO 03/099765

HPLC測定条件:A

ノ)レロスツ酸

HPLC保持時間: 3.56分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+, 489

寒施例4 (404)

3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2-(2-メトキシフェニル)エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)⁺

5

実施例4 (405)

NI(2-(2-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.27分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 566 (M+H)+

実施例4 (406)

25 ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

WO 03/099765

PCT/JP0J/06678

ーN-(2-(2-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.49分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 608 (M+H)⁺•

夷施例4 (407)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-デトラヒドロ-1-ナフチ

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (4ーメ

トキツベソジラ) アハノ) プロベン類

HPLC测定条件:A·

5

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)⁺。

奥施例4 (408)

15 アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-メト 3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)

キウベンジラ)アベノ) プロベン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.58分;

20 MASS $\mathcal{F}-\mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H) $^{+}$

奥施例4 (409)

フェニル) カルボニル) ーN-(4ーメトキシベンジル)アミノ)プロバン

HPLC测定条件:A

3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

25

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

寒施例4 (410)

ュニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-メトキシベンジル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

アロベン概

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

5 MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)+

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-メトキシベンジル) ア

ハノ) ノロバン酸

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)+

20 実施例4 (412)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) ア 3- (N- ((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルポニ

ハノ) アロバン酸

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.14分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)+,

188

PCT/JP03/06678

夷施例4 (413)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (4-

5 メトキシベンジラ) アミノ) プロベン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

5

实施例4 (414)

3- (N- ((2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)プロパン酸

HPLC测定条件:A

15 HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+,

奥施例4 (415)

3- (N- ((2-(2-(ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

20 ェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)+

3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-メトキシベンジル)アミノ)

ルロベン環

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)⁺。

実施例4 (417)

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)

10 レロバン概

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+

15 寒瓶例4 (418)

3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)

プロパン酸

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.73分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)+

夷施例4 (419)

3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-メトキシベンジル) アミノ)

レロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

奥施例4 (420)

3- (N- ((2- (2- ((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-メトキシベンジル) アミノ)

プロパン酸

HPLC阅定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)+

3- (N- ((2- (2- ((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (4ーメトキシベンジル) アミノ)

アロベン母

HPLC燃烷条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)⁺•

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (4-メトキシベンジル) ア 3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

爽施例4 (422)

20

ハノ) プロパン数

HPLC保持時間: 3.77分;

25 HPLC遊院条件:A

PCT/JP03/06678

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+。

夷施例4 (423)

3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) ア

ミノ) アロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.83分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

5

実施例4 (424)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ペンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-メトキシベンジル)ア

ハノ) レロバン数

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)+

実施例4 (425)

20 3- (N- ((2-(2-((4-(ten-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-メトキシベンジル)ア

ハノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)⁺。

PCT/JP0J/06678

寒施例4 (426)

3- (N- ((2-(2-((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-メトキシ

ベンジラ)アベノ) プロベン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.56分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+,

5 フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (4ーメトキシベンジル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+

5

夹施例4 (428)

3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-メトキシベンジル) アミノ)

20 レロスツ母

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+.

25 奥施例4 (429)

3- (N- ((2- (2- ((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル)

アミノ) プロバン殴

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 559 (M+H)+

実施例4 (430)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (4ー 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

メトキツベンジラ) アハノ) プロベン数

5

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.56分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)⁺。

15

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (4ーメトキシベンジル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルポニル) フ

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.84分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+.

夷施例4 (432)

3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー(4ーメトキツベンジル) アミノ)

ノロスソ酸

25

PCT/JP03/06678

HP LC盥炕条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+

S **夷施例4 (433)**

HPLC测定条件:A ニル) カァボニル) -N- (4-メトキツベンジル) アミノ) プロバン酸 3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

HPLC保持時間:3.56分;

10 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 473 (M+H)+

実施例4 (434)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) 3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 アペノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 559 (M+H)+,

20 夹施例4 (435)

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-メトキシベンジル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

レロベン製

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+。

HPLC测定条件:A

25

HPLC保持時間:3.85分;

195

実施例4 (436)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (4-3- (N- ((2- (2- (((1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

メナキツベソジラ) アハノ) プロベン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.55分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H) $^+$

6 **爽施例4 (437)**

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-メ 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4ーメチルフェニル) エチ

トキツベンジラ) アペノ) プロベン酸

HPLC測定条件: A

ᅜ HPLC保持時間:3.89分;

MASS F-9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)*

夷施例4 (438)

3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

20 カルボコル) フェコル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-メトキシベン

ジル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H) $^{+}$.

25

寒焔例4 (439)

WO 03/099765

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.71分;

MASS F-> (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)+

3- (N- ((2-(2-(((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,

3, 4ーテトラヒドロイソキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ ェニル) カルボニル) -N-(4-メトキツベンジル) アミノ) プロパン類

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.49分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H) $^+$;

HPLC保持時間:3.62分;

5

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)+, 475.

奥施例4 (441)

3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

20 エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-メトキシベンジル) アミノ)

レロスン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+.

<u> 実施例4 (442)</u>

ルロスツ酸

夷施例4 (443)

MASS $\vec{\tau} - \phi$ (ESI, Pos., 20V) : 559 (M+H)⁺.

HPLC保持時間: 3.84分;

アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (4-メトキシベンジル) 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2

ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

N-(4-メトキシベンジン)アミノ)プロバン数

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)⁺。

15

夷施例4 (444)

ル) -N-ベンジルアミノ) カアボニル) フェニル) フェニル) カアボニル) 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

-N-(4-メトキツベンジル)アミノ)プロバン酸

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.40分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 594 (M+H)+

夷施例4 (445)

25 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-メトキツベンジル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

プロスツ酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+,

夷施例4 (446)

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (ピ 3-(N-((2-(2-((1, 2, 3, 4-7)7)2)2-1-7)7)

リジソー4ーイバ) エチバ) アミノ) プロパン酸

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 548 (M+H)+, 131.

夹施例4 (447)

2 アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピ 3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル) リジンー4ーイバ) エチバ) アミノ) プロパン感

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.03分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)⁺

夷施例4 (448)

3- (N- ((2-(2-((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (ピリジン-4-イル) エチ

25 ゾ) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

199

NO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 558 (M+H)+,

夷施例4 (449)

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-4-イル) エチバ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:2.72分;

5 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)+, 255.

実施例4 (450)

ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-4-イル)エチ 3- (N- ((2-(2-((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

2 バ) アペノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)⁺。

20 寒施例4 (451)

ェニル) カルボニル) ーNー (2ー (ピリジンー4ーイル) エチル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

アロスン酸

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.07分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H) $^{+}$.

WO 03/099765

PCT/JP0J/06678

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-4-イル)エチ 3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

S ア) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)*

10 **爽施例4 (453)**

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-4-イル)エチ 3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ル) アミノ) プロスン酸

HPLC测定条件:A

15 HPLC保持時間: 3.20分;

MASS $\neq - \emptyset$ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H) $^{+}$.

夷施例4 (454)

3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ペンジルアミノ) カルボニ

20 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-4-イル)

エチル) アミノ) プロペン級

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H).

25

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ビリジン-4-イル) 3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ペンジルアミノ) カルボニ

エチル) アミノ) プロペン数

HPLC保持時間:3.40分;

HPLC測定条件:A

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+.

実施例4 (456)

3- (N- ((2-(2-((4-(tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-4-イル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.38分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+.

5

3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジ

ソー4ーイル) エチル) アミノ) プロパン数

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 2.98分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)+

25 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-4-イル)エ 3- (N- ((2- (2- ((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

PCT/JP03/06678

チァ) アミノ) プロパン殴

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.11分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)+.

実施例4 (459)

ル) エチル) アミノ) プロパン酸 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-4-イ 3- (N- ((2-(2-((2,5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)+.

実施例4 (460)

2 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2-

HPLC测定条件:A

(アリジンー4ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.00分;

20 MASS $\vec{\tau}-\vec{\rho}$ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)⁺, 201_e

夷施例4 (461)

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-4-イル) エチ

ラ) アミノ) アロバン製

25

HPLC阅定条件:A

203

HPLC保持時間:3.18分;

MASS $\vec{\tau} - \vec{\mathcal{Y}}$ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M + H) $^{+}$.

夷施例4 (462)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-4-イル)エ 3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

チル) アミノ) プロペン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.12分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)+.

実施例4 (463)

3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルポニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (ビリジンー4ーイル) エチ

15 ル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.20分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)⁺.

20 **夷施例4 (464)**

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-3- (N- ((2- (2- (((1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

(ピリジンー4ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

25 HPLC保持時間: 2.98分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+.

VO 03/099765

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+, 482, 282

実施例4 (468)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ビリジン-4-イル)エチ

3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

PCT/JP03/06678

寒施例4 (465)

3-(N-((2-(2-(((1R)-1-(4-x4)2x=x))x4)ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピ

リジンー4ーイル) エチル) アミノ) プロパン酸

5

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-

15

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 540 (M+H)⁺。

20 3, 4ーテトラヒドロイソキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

レロベン母

HPLC保持時間: 2.96分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)⁺, 282;

23

HPLC保持時間: 3.07分;

205

HPLC保持時間: 3.16分;

3- (N- ((2-(2-(((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2)

エニル) カルボニル) ーNー(2-(ピリジンー4ーイル) エチル) アミノ)

HPLC测定条件:A

爽施例4 (466) MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)+ HPLC保持時間: 3.22分; HPLC测定条件:A HPLC遊烷条件:A 3— (N— ((2— (2— ((1— (4—フルオロフェニル) エチルアミノ) 4ーイル)エチル)アミノ)プロパン酸

実施例4 (469)

5

HPLC保持時間:3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)⁺。

ブ) アミノ) プロパン数

HPLC测定条件:A

NI(2-(ピリジン-4-イル)エチル)アミノ)プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((N-メチルーN- (6-メチルビリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

2 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:2.74分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+, 432, 269.

奥施例4 (470)

20 3- (N- ((2-(2-((N-(2-(N, N-ジメチルアミノ) エチ -N-(2-(ピリジン-4-イル)エチル)アミノ)プロパン酸 ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 2.92分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H) $^+$, 290, 267.

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フ

ェニルエチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

S

HPLC保持時間: 3.97分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)⁺.

央施例4 (472)

10 3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェ

コパエチル)アミノ)プロパン酸

HPLC海底条件:A

HPLC保持時間: 3.66分;

MASS = - 9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+.

ᇙ

3- (N- ((2-(2-((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ーフェニルエチル) アミノ) ブ

20 ロバン原

HPLC测定条件: A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+.

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミ

ノ)レロスン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)⁺,

実施例4 (475)

3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) ブ

ロスン酸

5

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)⁺•

15 実施例4 (476)

3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル)アミノ)ブ

ロベン概

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.88分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)+.

寒施例4 (477)

.3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル)アミノ)プ

ロベン恩

PCT/JP03/06678

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+.

寒施例4 (478)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル)アミ 3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ノ) アロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

5

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+.

奥施例4 (479)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチルーNーベンジルアミノ) カルボニ

2 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエテル) アミ

ノ)レロベツ母

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)+.

20

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル)アミ

HPLC保持時間:4.13分;

夷施例4 (480)

3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - (ten-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ノ) レロパン酸

HPLC测定条件:A

25

209

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H).

実施例4 (481)

3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

/) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニル

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.66分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+.

5

実施例4 (482)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル)ア 3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ハノ) レロスン数

ᅜ HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+.

寒施例4 (483)

20 チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

HPLC測定条件:A

フェニアエチア) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.64分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+.

25

夷施例4 (484)

3- (N- ((2- (2- ((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル) アミノ) ブ

ロスソ窓

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+

5 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ーフェニルエチル) アミノ) ブ 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

7 MASS $\vec{\tau}-\vec{\mathcal{Y}}$ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)⁺

與施例4 (486)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-(((1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

20 フェニルエチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.66分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)

23 **爽施例4 (487)**

(N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

WO 03/099765

PCT/JT03/06678

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フ

ェニルエチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+.

夷施例4 (488)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2-フェニルエチ 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

5 ツ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.91分;

MASS $\vec{\tau}-\dot{\gamma}$ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)⁺

2 実施例4 (489)

3- (N- ((2- (2- (((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

ェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルエチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

8 HPLC保持時間:3.55分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.69分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)+, 459.

25 夷施例4 (490)

3ー (Nー ((2ー (2ー ((3ーメチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

PCT/JP03/06678

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル) アミノ) ブ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)⁺.

奥施例4 (491)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル)ア 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 ミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+

爽施例4 (492)

15

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

HPLC测定条件:A

N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC保持時間: 3.22分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H) $^{+}$.

夷施例4 (493)

ーN-(2-フェニアエチル)アミノ)プロバン殴

213

25

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.44分;

MASS = - 4 (ESI, Pos., 20V) : 578 (M+H)+.

実施例4 (494)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル) アミノ) ブ 3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

ロバン概

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間:3.88分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)+

実施例4 (495)

3- (N-)(2-)(2-)(1, 2, 3, 4-7)

15 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4 ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 577 (M + H) $^+$.

20

寒焔例4 (496)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4 3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

夷施例4 (497)

3- (N- ((2- (2- ((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

ニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) エチ

ラ) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.67分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)⁺.

5

実施例4 (498)

フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル)エチル) ア

3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルポニル) フェニル)

HPLC测定条件:A ミノ) プロパン酸

2

HPLC保持時間: 3.88分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 563 (M + H) $^+$.

寒施例4 (499)

20 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) エ 3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)*。

25

PCT/JP03/06678

WO 03/099765

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ 実施例4 (500)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニ

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 538 (M + H) $^+$.

実施例4 (501)

5 3- (N-((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ ハ) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.16分;

5 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+.

実施例4 (502)

3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリン ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2-

(4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

20

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)⁺

25 **東施例4 (503)**

3- (N- ((2- (2- ((aーメチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーメトキシフェニル) エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H).

エニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミ 3- (N- ((2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

5 ノ)レロスン概

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+,

2

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ **爽施例4 (505)**

チル) アミノ) プロパン酸

IIP L C 測定条件: A

20 HPLC保持時間:3.84分;

MASS = - 4 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H).

実施例4 (506)

3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーメトキシフェニル) エ

チル) アミノ) プロパン酸

217

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSF-4 (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+

夷施例4 (507)

ハ) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((N-エチルーN-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間:3.89分;

MASS $\vec{\tau} - \mathcal{Y}$ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)⁺.

実施例4 (508)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチルーN-ベンジルアミノ) カルボニ

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニ

ハ) エチア) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+

奥施例4 (509)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニ 3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - (tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ラ) エチア) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+,

夷施例4 (510)

ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (4-メ 3- (N- ((2-(2-((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ トキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASS = 9 (ESI, Pos., 20V) : 581 $(M+H)^+$.

5

奥施例4 (511)

エチル) アミノ) プロパン酸 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-メトキシフェニル) 3- (N- ((2-(2-((2-フルギロベンジルアミノ) ガルボニル)

HPLC測定条件:A

5

HPLC保持時間:3.80分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H) $^{+}$.

実施例4 (512)

20 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェ 3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニア) エチア) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H) $^{+}$.

25

WO 03/099765

夷施例4 (513) 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1-フェニルー2-ヒドロキシエ

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー

(4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)⁺.

実施例4 (514)

5 チル) アミノ) プロバン酸 エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-メトキシフェニル)エ 3- (N- ((2- (2- ((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

2 MASS $\vec{7}-\vec{9}$ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)⁺.

実施例4 (515)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) 3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

20 エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+

25 寒施例4 (516)

3- (N- ((2- (2- ((2, 6ージフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェ

ニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC浏定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)+

S

夷施例4 (517)

3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーメトキシフェニル) エ

ö チル)アミノ)プロバン数

HPLC避定条件:A

HPLC保持時間:3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+.

夷施例4 (518)

2

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3- (N- ((2-(2-(((1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ (4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間:3.62分;

MASS = - 9 (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H).

3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

25 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4 ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

221

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.93分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

東施例4 (520)

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2-(4-メトキ 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間:3.89分;

MASS $\overrightarrow{\tau} - \beta$ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H) $^{+}$.

実施例4 (521)

3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エ

チル) アミノ) プロパン酸

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

MASS = - 9 (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H).

20

夷施例4 (522)

3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2-(2-(((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, ェニル) カルボニル) ーNー (2-(4-メトキシフェニル) エチル) アミ

25 ノ) アロバン際

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.51分;

MASS $\vec{7}-\beta$ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)⁺:

HPLC保持時間: 3.66分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H) $^+$, 489.

契施例4 (523)

3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-メトキシフェニル) エ

チル) アペノ) プロパン酸

5 HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+.

夷施例4 (524)

5 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (4-メトキシフェ 3- (N-((2-(2-(3,5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニア) エチア) アミノ) プロパン感

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.88分

20 MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H).

爽施例4 (525)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

25 NI (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC短定条件:A

223

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.20分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 566 (M+H)+.

実施例4 (526)

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ ーN- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPI.C保持時間: 3.44分;

5 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 608 (M+H).

寒施例4 (527)

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) エ

5 チル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASSF-4 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+.

20 **奥施例4 (528)**

ーアミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルポニル) ーN- (2- (4 3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドロー1-ナフチ

HPLC阅定条件:A

23 HPLC保持時間:3.60分;

MASS = - 9 (ESI, Pos., 20V) : 626 (M+H)+.

寒施例4 (529)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (4 3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)

ーアミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC遊虎条件:A

HPLC保持時間: 3.33分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 630 (M+H)+,

5 **夷施例4 (530)**

ニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフェニ 3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

HPLC测定条件: A

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.34分;

5

 $MASS\vec{\tau}-\beta$ (ESI, Pos., 20V) : 576 $(M+H)^+$, 248.

奥施例4 (531)

3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

20 フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフェニル)エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.53分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 612 (M+H)+

寒施例4 (532)

25

225

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフェ 3 - (N - ((2 - (2 - ((1ーナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.59分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 636 (M+H)+,

実施例4 (533)

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ・

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニ ルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

5

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 2.96分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+

2

契施例4 (534)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニ 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ルフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 2.94分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)⁺.

実施例4 (535)

25

3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン -2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H).

奥施例4 (539)

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフェ 3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.47分;

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC阅点条件:A

HPLC保持時間: 3.53分;

5

HPJC巡灯采作:A

奥施例4 (537)

2 エニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチ

HPLC测定条件:A

227

與施例4 (538)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフ

ェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

25

(4ーアミノスルホニルフェニル)エチル)アミノ) プロパン酸

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 612 (M+H)

爽施例4 (536)

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H).

3- (N- ((2- (2- (ペンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

ブ) アミノ) プロバン数

HPLC保持時間: 3.45分;

MASS $\vec{\tau}-\dot{y}$ (ESI, Pos., 20V) : 586 (M+H)⁺

20

3 ー(N ー ((2 ー (2 ー ((2 ー メトキシベンジルアミノ)カルボニル)

HPLC測定条件:A

3 - (N - ((2 - (2 - ((αーメチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルポニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェ

HPLC保持時間:3.51分;

奥施例4 (540)

5

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)⁺。

HPLC保持時間:3.49分; HPLC测定条件:A

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフ 3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

2 ェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.44分;

MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H)+.

20 **奥施例4 (541)**

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフェ 3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間:3.56分;

MASS $\neq -$ $(ESI, Pos., 20V) : 620 (M + H)^{+}$

夷施例4 (542)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフ 3- (N- ((2-(2-((4-メトキツベンジルアミノ) カルボニル)

S ェール) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.40分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H)+.

5 爽施例4 (543)

リラ) エチラ) アッノ) プロパン殴 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (4-アミノスルホニルフェ 3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.51分;

2

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H).

夷施例4 (544)

3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

20 **ルフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸** ル) フェニル) フェニル) カルポニル) ーN-(2-(4-アミノスルホニ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.49分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)+.

夹施例4 (545)

25

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニ 3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.56分;

MASS $\vec{7}-\vec{7}$ (ESI, Pos., 20V) : 614 (M+H) $^{+}$.

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニ 3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ ルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.75分;

5 MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 642 (M+H) $^{+}$

<u> 実施例4(547)</u>

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニ 3 — (N — ((2 — (2 — ((4 — (tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

20 ルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASS $\vec{7}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 642 (M+H)⁺.

25 実施例4 (548)

3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

VVO 03/099765

PCT/JP03/06678

ミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(4-ア

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.29分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 630 (M+H)⁺。

S

東施例4 (549)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフ 3- (N- ((2- (2- ((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

5 ェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.45分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 604 (M+H)⁺。

15 **爽施例4 (550)**

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフ ェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC密点条件:A

20 HPLC保持時間:3.45分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 604 (M+H).

25 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホ 3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.47分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H) $^+$.

奥施例4 (552)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3 — (N — ((2 — (2 — (((1 R) -1 -7ェニルー2 -ヒドロキシエ (4ーアミノスルホニルフェニル)エチル)アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.27分;

MASS F-7 (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H)+

夷施例4 (553)

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフェ ール) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.53分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 620 (M+H)

20

実施例4 (554)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフ ェニル) エチル) アミノ) プロバン酸 3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.47分;

ニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 604 (M+H)+.

夹施例4 (555)

ニル) カルボニル) ーNー (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) 3- (N- ((2- (2- ((ブリルブミノ) カルボニル) フェニル) フェ

アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.25分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)⁺.

5

爽施例4 (556)

3- (N- ((2- (2- ((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ ニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホ

2 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.44分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H)+

夷施例4 (557)

20 3- (N- ((2- (2- ((3-クロロベンジルアミノ) カルポニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフェ

HPLC测定条件:A

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.55分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 620 (M+H)⁺•

25

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

寒肺例4 (558)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-3- (N- ((2-(2-((((1S) -1-フェニルー2-ヒドロキシエ (4ーアミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.27分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H)+

実施例4 (559)

5 HPLC測定条件:A ーアミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (4 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

HPLC保持時間:3.56分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 614 (M+H)⁺。

実施例4 (560)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (4-アミノ 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

20 スルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.53分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 618 (M+H).

23 **爽施例4 (561)**

3ー(Nー ((2ー (2ー ((2ーチエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェ

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.40分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)+

夷施例4 (562)

3- (N- ((2-(2-(((3S) -3-ヒドロキシメチルー1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

5 エニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチ

ル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.23分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 642 (M+H)⁺;

2 HPLC保持時間:3.36分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 642 (M+H)⁺

3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

20 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (4-アミノスルホニルフェ

HPLC保持時間:3.53分;

夷施例4 (564)

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)⁺。

25

HPLC测定条件:A

235

VO 03/099765

PCT/JP0J/06678

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホ 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ ニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン感

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.51分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H) $^{+}$.

実施例4 (565)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルビリジン-2

5 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー N-(2-(4-アミノスルホニルフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 2.96分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)+, 361。

15

実施例4 (566)

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

-N-(2-(4-アミノスルホニルフェニル)エチル)アミノ)プロパン

20

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 657 (M+H) $^+$, 403.

25 **夷施例4 (567)**

3ー(N-((2-(2-((2-フェニルエチルアミノ)カルボニル)フ

VVO 03/099765

PCT/JP03/06678

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフェ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.49分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)+

裏施例4 (568)

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-(N-((2-(2-((1, 2, 3, 4-f)5kka-1-f)f)

5 4ージクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.21分;

MASS = - 9 (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H).

2 **夷施例4 (569)**

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2-(2, 3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) 4ージクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.88分:

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 619 (M+H)+

エチル) アミノ) プロパン酸

ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,4-ジクロロフェニル)

237

夷施例4 (570)

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

દ્ધ

HPLC保持時間:4.21分;

HPLC测定条件:A

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 625 (M+H)+.

実施例4 (571)

ェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフ 3 - (N - ((2 - (2 - (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間:3.44分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H).

夷施例4 (572)

3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

15 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,4-ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.11分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H)+.

20

実施例4 (573)

ュニル) カルボニル) ーNー (2ー (2, 4ージクロロフェニル) エチル) 3- (N- ((2-(2-((ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

アミノ) プロパン酸

25 HPLC湖定条件:A

HPLC保持時間:4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 575 (M+H)+

奥施例4 (574)

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

S ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェニル)

HPLC测定条件:A エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:4.11分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H).

裏施例4 (575)

5

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,4-ジクロロフェニル) 3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A **メチラ) アッノ) ノロパン顋**

5

HPLC保持時間:4.17分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H) $^+$.

20 ル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェニル) エ 3- (N- ((2- ((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

25

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 605 (M+H)+.

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

奥施例4 (577)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,4-ジクロロフ 3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ ェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.17分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)+,

実施例4 (578)

5 3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ ェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.34分;

15 MASS $\neq -$ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H) $^+$.

実施例4 (579)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,4-ジクロロフ 3- (N- ((2- (2- ((4- (tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

20 ェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.35分;

MASS = - > (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H)+

23 実施例4 (580)

3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ージクロロフェール) エチル) アミノ) プロバン酸 ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 4

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 619 (M+H)⁺。

実施例4 (581)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,4-ジクロロフェニ 3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

5 ラ) エチラ) アペノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)⁺。

2 **寒施例4 (582)**

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,4-ジクロロ (N- ((2- (2- ((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間:4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+,

25 (2, 4ージクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

テルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 605 (M+H) $^{+}$.

実施例4 (584)

エチル) アミノ) プロバン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェニル) 3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間:4.15分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : $609 (M + H)^{+}$

寒施例4 (585)

3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

5 フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェニ ハ) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+

20

実施例4 (586)

メチラ)アミノ)プロパン数 エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,4-ジクロロフェニル) 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.21分;

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASS $\overrightarrow{\pi}$ - $\cancel{\Rightarrow}$ (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H) $^{+}$.

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-(4-メチルフェニル) エチ

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.22分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H) $^{+}$

20 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) クロロフェニル) エチル) アミノ) プロパン感 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,4-ジ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.15分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+,

寒施例4 (588) MASS = (ESI, Pos., 20V) : 605 (M+H). HPLC保持時間: 3.88分; HPLC测定条件:A 3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ 4ージクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 (2, 4ージクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5

実施例4 (590)

3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2.

エニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェニル) エチル)

アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H)+, 527

5

奥施例4 (591)

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 4-ジクロロフェニル) 3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

15 エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.15分;

MASS 7-4 (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H)+

20 実施例4 (592)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 4-ジクロロ 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

フェニル) エチル) アミノ) プロパン樹

HPLC测定条件:A

25 HPLC保持時間: 4.13分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 611 (M + H) $^{+}$

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

实施例4 (593)

N- (2- (2, 4-ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

HPLC测定条件:A

奖施例4 (594)

5

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,4-ジクロロフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸 3 - (N - ((2 - (2 - ((N - (2 - (N, Nージメチルアミノ) エチ

HPLC遊院条件:A

HPLC保持時間: 3.62分;

5

MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 646 (M+H)+.

夹施例4 (595)

20 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,4-ジクロロフェニル) 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルポニル) フ

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:4.13分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H).

夹施例4 (596)

25

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2

S

HPLC保持時間: 3.40分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 604 (M+H)+

実施例4 (597)

3- (N- ((2- (2- ((Nーベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)+,

HPLC保持時間: 4.01分; HPLC湖定条件:A ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-(4 3- (N-((2-(2-((1, 2, 3, 4-デトラヒドロ-1-ナフチ

ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5 アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-(4 ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.71分;

HPLC測定条件:A

MASS #- 9 (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

2

夷施例4 (598)

チバ)アベノ)プロパン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (4-エトキシフェニル) エ 3- (N- ((2- (2- ((1ーナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)+

23 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ハ) エチア) アミノ) プロパン感

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.33分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)⁺.

夷施例4 (600)

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニ

5

ᅜ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロバン酸

夷施例4 (602)

20

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.95分;

MASS 5-8 (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H). HPLC保持時間: 3.25分; HPLC测定条件:A **夷施例4 (601)** ル) エチル) アミノ) プロパン酸

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)⁺。

3- (N- ((2- (2- ((a-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (4-エトキシフェニル) エ

HPLC测定条件:A

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)⁺。

実施例4 (603)

3- (N- ((2- (2- ((ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

ェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーエトキシフェニル) エチル) アミ

ノ)レロスン概

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+。

5

実施例4 (604)

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルポニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エ

チル) アミノ) プロパン酸

2 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H).

奥施例4 (605)

20 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル) エ 3- (N-((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+,

夹施例4 (606)

ル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル) エチル) 3- (N- ((2- ((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニ

アペノ) プロパン殴

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

5 夹施例4 (607)

万) エチブ) アペノ) プロパン数 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC 回定条件:A

2 HPLC保持時間: 3.99分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)+.

奥施例4 (608)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチルーN-ペンジルアミノ) カルボニ

20 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-エトキシフェニ

ハ) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.15分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H) $^{+}$.

奥施例4 (609)

25

249

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2- (2- ((4- (tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ ル) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.19分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+

夷施例4 (610)

3- (N- ((2- (2- ((1ーフェニルー3-ヒドロキシプロピルアミ

5 ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エ

トキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン殴

HPLC翘定条件:A

HPLC保持時間:3.71分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

奥施例4 (611)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-エトキシフェ 3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) エチル) アミノ) プロバン唇

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+

寒施例4 (612)

25 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー

(4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H) $^{+}$

夷施例4 (613)

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル)エ

チル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASS = - 9 (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H).

夷施例4 (614)

2 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル)エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC遡烷条件: A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+.

20

爽施例4 (615)

25

 $3-(N-((2-(2-(((1S)-1-7_{=})-2-k_{-}+k_{-$ チルフミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-

(4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

WO 03/099765

HPLC保持時間:3.71分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H).

実施例4 (616)

3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-(4-メチルフェニル) エチ ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4 ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.04分;

5 MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H).

奥施例4 (617)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキ 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

5 シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.99分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 583 (M+H).

20 夷施例4 (618)

エニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーエトキシフェニル) エチル) アミ 3, 4ーテトラヒドロイソキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2- (2- (((3S) -3-ヒドロキシメチルー1, 2,

ノ)レロバン酸

25 HPLC测点条件:A

HPLC保持時間: 3.60分;

MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.78分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+, 503,

安施例4 (619)

エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-エトキシフェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)⁺。

爽施例4 (620)

3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

2 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-エトキシフェ

ニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC遡定条件:A

HPLC保持時間: 3.96分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+,

20

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルビリジン-2

23

253

夷施例4 (621)

ーイル)メチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)ー

HPLC保持時間: 3.29分;

NI(2-(4-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC测定条件:A

PCT/JP03/06678

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)+,

実施例4 (622)

3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

ーNー (2ー (4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.51分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H) $^{+}$.

10

実施例4 (623)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル) エ 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

チル) アミノ) プロパン酸

15 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)⁺.

寒肺例4 (624)

20 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-フ

ルメロベンジア)アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

25 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H).

実施例4 (625)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-フル 3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)

メロベンジラ)アベノ) プロベン唇

S HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H) $^{+}$.

夹施例4 (626)

5 フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) プロパン 3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

2 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+

夹施例4 (627)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

アロバン酸

20

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

 $MASS \neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)⁺

25 **夷施例4 (628)**

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) ア

ミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASS $\vec{\tau} - \vec{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)⁺.

<u> 実施例4 (629)</u>

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル)ア 3- (N- ((2-(2-((ビリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ミノ) プロパン酸

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.14分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)+.

ᅜ 実施例4 (630)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリン ファオロベンジァ) アミノ) プロパン酸 -2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.86分;

MASS=-> (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H).

夷施例4 (631)

3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-フルオロベンジル) アミノ)

25

256

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)+.

寒施例4 (632)

ェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2-(2-((ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

5 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 511 (M+H)

爽施例4 (633)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル)アミノ) 3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

5 アロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H) $^{+}$.

20 夷施例4 (634)

3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

25

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)+.

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

実施例4 (635)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル)アミノ) 3- (N- ((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

プロスン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H).

5

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

プロスン概

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間:3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 545 (M+H)⁺•

実施例4 (637)

3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル) アミノ)

レロベン酸

20

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+.

25

実施例4 (638)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) 3 ー(N ー ((2 ー (2 ー ((4 ーメチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

アロスツ酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS $\neq - \emptyset$ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H) $^{+}$.

爽施例4 (639)

3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-フルオロベンジル)ア

ツノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H).

5

夷施例4 (640)

3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル)ア

バノ) アロバン酸

20 HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.91分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H) $^{+}$

夷施例4 (641)

25 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) ア 3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

ハノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H).

5 HPLC測定条件:A ミノ) プロパン酸

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) ア 3- (N- ((2- (2- ((4- (tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC保持時間:4.10分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)⁺.

実施例4 (643)

5 3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロ

ベンジラ)アミノ)プロバン段

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H).

20

夷施例4 (644)

3- (N- ((2- (2- ((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-フルオロベンジル)アミノ)

25 プロスソ概

HPLC測定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.80分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H).

寒肺例4 (645)

アロバン酸 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (4ーフルオロベンジル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC阅定条件: A

HPLC保持時間:3.82分;

0 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)⁺。

夷施例4 (646)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-フルオロベンジル) 3- (N- ((2- (2- ((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H) $^{+}$

20 夷施例4 (647)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (4-3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

HPLC测定条件:A

ファオロベンジア) アッノ) プロバン酸

HPLC保持時間: 3.60分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+.

WO 03/099765

夹施例4 (648)

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル) アミノ)

プロスツ酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 545 (M+H)+.

夷施例4 (649)

5

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-フルオロベンジル)アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC测定条件:A

プロパン製

15 HPLC保持時間:3.78分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)+.

寒肺例4 (650)

3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

ニル) カルボニル) -N-(4-フルギロベンジル) アミノ) プロバン数

HPLC测定条件:A

20

HPLC保持時間:3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 461 (M+H)+。

25 夹施例4 (651)

3- (N- ((2- (2- ((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル)

アペノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+

夹施例4 (652)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 アロベン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 545 (M+H)⁺。

2 実施例4 (653)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ ファギロベンジラ) アッノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

. 20 HPLC保持時間: 3.60分;

MASS = 9 (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+

25 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (4-フ 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

ラギロベンジラ) アベノ) プロベン酸

PCT/JP03/06678

HPLC測定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+,

夷肺例4 (655)

ジラ) アミノ) プロスン数 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (4ーフルオロベン 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間:3.88分;

MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+

実施例4 (656)

3- (N- ((2- (2- ((2ーチエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

5 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (4ーフルオロベンジル) アミノ) レロベン概

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.73分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 517 (M+H)+.

20

実施例4 (657)

3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, ェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.49分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.66分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)⁺。

S 夹施例4 (658)

ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(4-フルオロベンジル)アミノ) 3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

アロスン酸

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間:3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)⁺。

夹施例4 (659)

3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルギロベンジルアミノ) カルボ

2 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル)

アハノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+

爽施例4 (660)

20

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルビリジン-2 ーイハ)メチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)ー

25 HPLC测定条件:A

NI(4ーファオロベンジア)アミノ)プロパン酸

HPLC保持時間:3.18分;

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 540 (M+H)+

実施例4 (661)

3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

-N-(4-フルオロベンジル)アミノ)プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.40分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)+,

5

実施例4 (662)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル)アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

ルロベン圏

2 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)+.

実施例4 (663)

20 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2 3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドロー1-ナフチ ーメチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)+

25

266

爽施例4 (664)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2 3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) ーメチルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

S HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+,

爽施例4 (665)

5 フェニル) カルボニル) ーNー (2-(2-メチルフェニル) エチル) アミ 3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル) ノ) アロバン母

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.01分;

ᅩ MASS = (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+

実施例4 (666)

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチ

ア) アミノ) プロパン酸

20

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)

25 実施例4 (667)

3 - (N - ((2 - (2 - (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

VVO 03/099765

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル)

PCT/JP03/06678

エチバ) アミノ) プロパン製

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.29分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+,

実施例4 (668)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メチルフェニル) 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

5 エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+。

5 夷施例4 (669)

-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン (2ーメチルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+

寒施例4 (670)

3- (N- ((2- (2- ((αーメチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチ

ラ) アペノ) プロパン製

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.99分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

S

ェニル) カルボニル) ーNー (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-(ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

レロスソ酸

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間:3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)⁺•

夷施例4 (672)

3- (N- ((2-(2-((2-メトキツベンジルアミノ) カルボニル)

2 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル) エ

チル) アミノ) プロパン数

HPLC遊虎条件:A

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

HPLC保持時間: 3.91分;

夷施例4 (673)

20

25 HPLC测定条件:A

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーメチルフェニル) エチ 3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ゾ) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.99分;

VVO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 535 (M + H) $^{+}$

<u> 実施例4(674)</u>

3- (N- ((2-(2-((3-メトキウベンジルアミノ) カル共ニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル) エ

チル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+。

5

夷施例4 (675)

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2-メチルフェニル) エチ 3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ラ) アペノ) プロペン数

2 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+

奥施例4 (676)

20 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メチルフェニル)エ 3- (N- ((2- (2- ((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

25 MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

ル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メチルフェニル) エチ 3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

S

HPLC保持時間:3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

実施例4 (678)

5 **エチラ) ア ハノ) プロパン**酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル) 3 - (N - ((2 - (2 - ((N - メチルーN - ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC測定条件:A

HPLC保控時間:3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)⁺。

15

夷施例4 (679)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル) (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

20 エチル) アベノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+。

25 **奥施例4 (680)**

3- (N- ((2-(2-((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メチルフェニル)

エチラ) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 4.21分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)⁺.

実施例4 (681)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) 3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - (tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

5 エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.22分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H) $^{+}$

2 **夷施例4 (682)**

チルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メ 3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルブミ

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間:3.73分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+.

実施例4 (683)

3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

25 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル)エ チバ) アベノ) プロパン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)[†]。

寒施例4 (684)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル)エ 3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

チル) アベノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.95分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+

夷施例4 (685)

3- (N- ((2-(2-((2, 5ージフルオロベンジルアミノ) カルボ

7 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メチルフェニ

HPLC测定条件:A

ハ) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.93分

MASS=-> (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

夷施例4 (686)

20

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-3 - (N - ((2 - (2 - (((1R) -1-フェニルー2ーヒドロキシエ

(2ーメチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

25

HPLC保持時間: 3.73分;

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

実施例4 (687)

3- (N- ((2- (2- ((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メチルフェニル) エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H).

5

夷施例4 (688)

3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2-メチルフェニル) エ

チブ) アミノ) プロパン酸

15 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+.

実施例4 (689)

20 3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

ニル) カルボニル) ーNー(2-(2-メチルフェニル)エチル)アミノ)

アロスソ概

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.73分;

25 MASS F-9 (ESI, Pos., 20V) : 471 (M+H)+

裏施例4 (690)

3- (N- ((2-(2-(2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保控時間:3.88分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)⁺.

寒施例4 (691)

10 3- (N- ((2- (2- (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチ

う) アッノ) ノロバン恩

HPLC遺伝条件: A

HPLC保持時間:4.02分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)⁺。

夷施例4 (692)

3 - (N - ((2 - (2 - (((1S) -1 -フェニル-2 -ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN - (2 -

20 (2ーメチルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC遊炕条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H) $^+$.

25 実施例4 (693)

3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン穴

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+,

実施例4 (694)

3- (N- ((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチル

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)⁺。

15 実施例4 (695)

3- (N- ((2-(2-((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(2-メチルフェニル) エチ

ブ)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+.

寒施例4 (696)

·3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2,

25 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー 2ーイル) カルボニル)フェニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-メチルフェニル)エチル)アミノ)

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

レロベン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.60分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.77分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+

夷施例4 (697)

3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチ

ラ) アミノ) ノロバン礟

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.96分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

爽施例4 (698)

5

3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メチルフェニ

ハ) エチハ) アミノ) プロパン母

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASS F-9 (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+.

爽施例4 (699)

25

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.27分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)⁺。

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

HPLC测定条件:A

5

HPLC保持時間:3.51分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)+

実施例4 (701)

5 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ ア) アミノ) プロパン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーメチルフェニル) エチ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

20

実施例4 (702)

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ

5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+。

实施例4 (703)

S 3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2,

5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC短定条件:A

HPLC保持時間:3.66分;

5 MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+

3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

ニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 5ージメトキシフェニル)

2 エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC迴烷条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASS 7-4 (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

20

3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2, 5ージメトキシフェニル) エチ

ア) アペノ) プロパン徴

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+

279

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2- (2- ((1ーナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 5-ジメトキシフェニ

ラ) エチラ) アミノ) プロパン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)+

5 寒施例4 (707)

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシ

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

7 HPLC保持時間: 3.27分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)+

寒施例4 (708)

3- (N- ((2-(2-((ビリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

20 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (2, 5-ジメトキシ

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)+,

25

実施例4 (709)

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン (2, 5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

S

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H).

寒施例4 (710)

3- (N- ((2-(2-((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

-0 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 5-ジメトキシフェニ ハ) エチハ) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

夹施例4 (711)

15

3- (N- ((2-(2-((ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

ェニル) カルボニル) ーNー(2-(2,5-ジメトキシフェニル)エチル)

アハノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

20

HPLC保持時間:3.82分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

25 3- (N- ((2-(2-((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 5-ジメトキシフェ **実施例4 (712)**

リア) エチア) アミノ) プロバン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

実施例4 (713)

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

夷施例4 (714)

5 ニア) エチア) アペノ) プロパン酸 フェニル) フェニル) カルポニル) ーN- (2- (2, 5ージメトキシフェ 3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

実施例4 (7.15)

3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 5-ジメトキシフェニ

25 ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

VAO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.97分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)+.

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキシフェ 3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

班施例4 (717)

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2-(2、5-ジメトキシフェニ (N- ((2- (2- ((4ーメチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

2 ル) エチル) アミノ) プロバン酸

HP1C避烷条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

20 **夷施例4 (718)**

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

25

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,5-ジメトキシ HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.84分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H).

PCT/JP03/06678

実施例4 (719)

3- (N- ((2- (2- ((N-インプロピルーNーベンジルアミノ) カ ルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメ

トキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン類

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H)+

5 夷施例4 (720)

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,5-ジメトキシ 3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPI.C測定条件:A

ᅜ HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

実施例4 (721)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

20 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,5-ジメトキシ

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.11分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H).

25

実施例4 (722)

284

ļ

3- (N- ((2-(2-((4-(tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキシ

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.13分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)+,

爽姉例4 (723)

3- (N- ((2-(2-((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

5 ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5

ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.64分

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H) $^+$

5

夹施例4 (724)

3- (N-((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,5-ジメトキシフェ

コル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC遊院条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+

25 3- (N-((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,5-ジメトキシフェ

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

コパ) エチパ) アペノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H) $^+$

実施例4 (726)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキ ·3- (N- ((2- (2- ((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)+

夷施例4 (727)

5 テルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

(2, 5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.66分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

実施例4 (728)

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 5-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 ラ) エチハ) アミノ) プロパン製

HPLC测定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)+

夹施例4 (729)

S フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフェ 3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+,

夷施例4 (730)

3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ ニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフェニル) エチル)

2 アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.66分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 517 (M+H)+

20 **爽施例4 (731)**

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,5-ジメトキ 3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジファギロベンジァアミノ) カア共

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

287

25

MASS ₹- Ø (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)⁺.

裏施例4 (732)

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H) $^+$.

5 実施例4 (733)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-3 - (N - ((2 - (2 - (((1S) - 1 - フェニルー 2 - ヒドロキシエ (2, 5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

₹ HPLC保持時間: 3.66分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

実施例4 (734)

3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4ーメチルフェニル) エチ

20 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2– (2,

5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HP LC阅烷条件: A

HPLC保持時間:3.97分;

MASS = - 4 (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H).

25

寒施例4 (735)

PCT/JP03/06678

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 5-ジ 3- (N- ((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ) メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H) $^+$

夷施例4 (736)

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2-(2, 5-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

5

HPLC测定条件:A

ハ) エチハ) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)+

夷施例4 (737)

5

3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキンメチル-1, 2, エニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキシフェニル) エチル)

アミノ) プロパン酸

20

HPLC巡定条件:A

HPLC保持時間:3.55分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.71分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)+,

実施例4 (738)

ア) エチア) アミノ) プロパン酸 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 5-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASS $\vec{\tau}$ - \not (ESI, Pos., 20V) : S81 (M+H) $^{+}$

実施例4 (739)

5 シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキ 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

2 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)+

実施例4 (740)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

N- (2- (2, 5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

20

HPLC保持時間: 3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 596 (M+H)+.

ટ્ડ 実施例4 (741)

3ー (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

į

PCT/JP03/06678

PCT/JP03/06678

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロベン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.47分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 638 (M+H)⁺•

爽施例4 (742)

3- (N- ((2-(2-((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(2, 5-ジメトキシフェニ

10 ア) エチア) アッノ) プロバン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保特時間:3.89分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H) $^+$.

15 実施例4 (743)

3- (N-((2-(2-((1,2,3,4-デトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-1・キシー4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC營定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.91分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 621 (M+H)+.

夷施例4 (744)

3- (N- ((2- (2- ((N-ベンジル-N- (2-ヒ ヒロキシエチル)) 7*/) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3

ーエトキシー4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

WO 03/099765

HPLC保持時間:3.60分;

HPLC測定条件:A

MASS $\vec{\tau}$ - \not (ESI, Pos., 20V) : 625 (M+H) $^{+}$.

実施例4 (745)

3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(3-エトキシー4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

10 HPLC保持時間: 3.63分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 571 (M + H)⁺.

爽施例4 (746)

3 - (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

12 フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC遡広条件:A

11 t Cody

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H) $^+$.

20

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルポニル) フェニル) フェニル) カルポニル) -N- (2- (3-エトキシー4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

25 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.91分;

NO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H)+,

3- (N- ((2-(2-((ビリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

S メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-

HPLC海流条件:A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)+,

班施例4 (749)

5

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-

メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

5

HPLC保持時間: 3.14分

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)+

20 3- (N-((2-(2-((1, 2, 3, 4-デトラヒドロインキノリン ー2ーイル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-

HPLC测定条件:A

(3-エトキシー4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC保持時間:3.80分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)⁺。

3- (N- ((2-(2-((α-メチルペンジルアミノ) カルボニル) フ シフェニル) エチル) アミノ) プロパン感 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシー4-メトキ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+,

実施例4 (752)

5 3- (N- ((2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ エチル) アミノ) プロパン酸 ェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.75分;

ᅜ MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

夷施例4 (753)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-エトキシ-4-メト 3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

20 キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H).

25 **夷施例4 (754)**

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

294

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン樹 ェニル) フェニル) カルポニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)⁺。

喪施例4 (755)

3- (N-((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メト

5 キシフェニア) エチア) アミノ) プロペン感

HPLC阅烷条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+.

2 **奥施例4 (756)**

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーエトキシー4ーメトキ 3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ シフェニル) エチル) アミノ) プロパン数

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.88分;

3- (N- ((2- (2- ((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン殴

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)+

夷施例4 (757)

23 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (3-エトキシー4-メト

WO 03/099765

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H) $^{+}$.

夷施例4 (758)

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキ 3- (N- ((2- (2- ((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

10 HPLC保持時間: 3.82分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{9}$ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H) $^{+}$.

夷施例4 (759)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

7 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H) $^{+}$

20

実施例4 (760)

ルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ ー4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 3 ー (N ー ((2 ー (2 ー ((N ーイソプロピルーN ーペンジルアミノ) カ

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)⁺。

3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

S ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H).

5

3- (N- ((2-(2-((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-

メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

5

HPLC保持時間;4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)⁺, 388。

実施例4 (763)

20 3- (N- ((2-(2-((4-(tertブチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルポニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-

メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)+

夷施例4 (764)

3- (N- ((2-(2-((1ーフェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-エ

トキシー4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.56分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - \cancel{y} (ESI, Pos., 20V) : 625 (M+H)⁺.

<u> 実施例4(765)</u>

5 3- (N- ((2- (2- ((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メト

キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.75分;

2 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)+

夷施例4 (766)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メト 3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

20 キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)+

ટ્ટ 実施例4 (767)

3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-エトキシー4 ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC遊伝条件:A

HPLC保控時間: 3.80分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)+

S

寒施例4 (768)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

5 (3ーエトキシー4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.58分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) :611 (M+H)+。

2 **爽施例4 (769)**

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン暦 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーエトキシー4ーメトキ 3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間:3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)+

夹施例4 (770)

25 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メト 3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

299

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H).

夷施例4 (771)

エチル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ ニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.58分;

5

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 531 (M+H)+.

実施例4 (772)

3- (N- ((2- (2- ((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4 ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.75分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)

20

実施例4 (773)

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキ 3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

PCT/JP03/06678

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+II)+

3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー

HPLC測定条件:A (3ーエトキシー4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.58分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+

5

爽施例4 (775)

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3 ーエトキシー4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

2 HPLC浏定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H) $^{+}$

裏施例4 (776)

20 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (3-エトキ 3- (N- ((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

25

HPLC保持時間:3.84分; HPLC测定条件:A シー4ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン殴

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 613 (M+H)+

奥施例4 (777)

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキ 3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.71分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H) $^+$

実施例4 (778)

5 エニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシー4-メトキシフェニル) 3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC保持時間: 3.47分;

HPLC測定条件:A

MASS $\vec{7}-\vec{9}$ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)⁺;

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)+, 533.

20 寒焔例4 (779)

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2 - (3 - エトキシー4 - メトキ 3- (N-((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間:3.82分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

301

実施例4 (780)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (3-エトキシー4 (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン数

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.84分;

MASS 7-4 (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)+

夹施例4 (781)

õ

N- (2- (3-エトキシー4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロ ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2

HPLC測定条件:A

2

HPLC保持時間:3.18分;

MASSF-> (ESI, Pos., 20V) : 610 (M+H)+, 596,

20 3- (N- ((2-(2-((N-(2-(N, N-ジメチルアミノ) エチ **ル) -N-ベンジアアミノ) カアボニル) フェニル) フェニル) カアボニル)** ーN-(2-(3-エトキシー4-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プ

HPLC保持時間:3.40分;

25

奖施例4 (782)

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{\vartheta}$ (ESI, Pos., 20V) : 652 (M+H)⁺.

303

HPLC測定条件:A

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキ 3- (N- ((2-(2-((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M + H)⁺.

5 寒施例4 (784)

ーメトキシー4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ハアミノ) カパボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ

IIP L C測定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

ᅜ

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 621 (M+H)+,

実施例4 (785)

3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)

20 アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-(3 ーメトキシー 4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 625 (M+H)+

25

実施例4 (786)

PCT/JP03/06678

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 ニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-エトキシ (N- ((2- (2- ((2-フリルメデルアミノ) カルボニル) フェ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)⁺。

奥施例4 (787)

3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

5 フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシ-4-エトキシフェニ

ラ) エチラ) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+

夹施例4 (788)

ᅜ

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-メトキシー4-エトキ

シフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASS $\vec{\tau} - \beta$ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H) $^{+}$

寒施例4 (789)

25 3 - (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメテルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシ-4-

エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)+

実施例4 (790)

エトキシフェニハ) エチハ) アミノ) プロパン暦 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシー4-3- (N- ((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)+

実施例4 (791)

5 3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン ー2ーイル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3ーメトキシー4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

20 MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)⁺,

実施例4 (792)

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-メトキシー4-エトキ 3- (N- ((2-(2-((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 シフェニル) エチル) アミノ) プロパン類

HPLC测定条件:A

S92660/E0 OAN

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{\sigma}$ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)⁺.

夹施例4 (793)

3 - (N - ((2 - (2 - (ベンジルアミノ) カルボコル) フェニル) フ エニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーメトキシー4ーエトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

5 MASS = (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

寒施例4 (794)

3- (N- ((2-(2-((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNI (2- (3-メトキシー4-エト

キツフォニラ) エチラ) アミノ) プロベン製

2

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+

20

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

13

307

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシー4-エトキ

HPLC保持時間: 3.84分;

PCT/JP03/06678

夷施例4 (796)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシー4-エト 3- (N-((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+

5 **奥施例4 (797)**

シフェニア) エチア) アッノ) プロパン製 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2 - (3 - メトキシー4 - エトキ 3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

2 HPLC保持時間: 3.89分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)+,

夷施例4 (798)

3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

20 キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシー4-エト

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+.

25

実施例4 (799)

308

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-メトキシー4-エトキ 3- (N- ((2- (2- ((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン感

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+,

夹施例4 (800)

(N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシー4-

エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

実施例4 (801)

5

3- (N- ((2- (2- ((N-エチャーNーペンジルブミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-

エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H)+

東施例4 (802)

25 3- (N- ((2- (2- ((Nープチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-

WO 03/099765

HPLC測定条件:A

エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:4.06分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)⁺, 388.

夷施例4 (803)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-3- (N- ((2- (2- ((4- (tertプチル) ベンジルアミノ) カルボニ

エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

10 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)+

寒施例4 (804)

15))カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3-× .3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ トキシー4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.58分;

20 MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 625 (M+H)+

実施例4 (805)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-エト 3- (N- ((2- (2- ((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)+

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-エト 3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン樹

HPLC保持時間:3.80分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)+

5

奥施例4 (807)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシ-4 3- (N- ((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC浏定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASS = 4 (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)+

20 夹施例4 (808)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー 3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

(3ーメトキシー4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

25

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+

HPLC保持時間:3.58分;

WO 03/099765

実施例4 (809)

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-メトキシー4-エトキ 3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

シフェニル) エチル) アミノ) プロバン類

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)+

5 **実施例4 (810)**

キシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-エト 3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC测定条件:A

2 HPLC保持時間: 3.78分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)+

3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

20 ニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシー4-Hトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.60分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 531 (M+H)+

25

3

PCT/JP03/06678

3 - (N - ((2 - (2 - ((2, 6 - ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N - (2 - (3 - メトキシー 4 - エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)+

爽施例4 (813)

3ー(N-((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フ

10 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-エトキ

シフェニア) エチア)アミノ) プロパン樹

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H).

15

実施例4 (814)

3- (N- ((2-(2-(((1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-

(3ーメトキシー4ーエトキシフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.58分;

MASS $\mathcal{F} - \mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H) $^{+}$

25 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3

ーメトキシー4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H)⁺,

v

寒焔例4 (816)

3- (N- ((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシー4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 613 (M + H) $^{+}$

<u> 実施例4 (817)</u>

15 3- (N- ('(2- (2- ((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシー4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

20 MASSF-4 (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+

実施例4 (818)

3-(N-((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フ

25 ェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-エトキシフェニル)

エチノ)アベノ) プロパン製

PCT/JP03/06678

HPLC闿定条件:A

HPLC保持時間: 3.51分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)+;

HPLC保持時間:3.66分;

MASS7-9 (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H) $^+$, 533,

英施例4 (819)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシー4-エトキ 3- (N- ((2-(2-((3-メFルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 シフェニア) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)⁺•

5

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ ーエトキシフェリア) エチア) アベノ) プロパン製

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.84分

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)⁺•

<u> 実施例4 (821)</u>

25 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2

N- (2- (3-メトキシー4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロ

スン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASS $\vec{\tau}$ - \not (ESI, Pos., 20V) : 610 (M+H) $^+$.

寒施例4 (822)

ーNー(2-(3-メトキシー4-エトキシフェニル)エチル)アミノ)ブ **ル)-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)** 3- (N- ((2-(2-((N-(2-(N, Nージメチルアミノ) エチ

ロバン酸

5

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.42分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 652 (M+H)+

5 **夷施例4 (823)**

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシ-4-エトキ 3- (N- ((2-(2-((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.84分;

MASS $\vec{\tau}-\dot{\rho}$ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)⁺

実施例4 (824)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ

25 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

PCT/JP03/06678

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H) $^+$

5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 アミノ) カパボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 3- (N- ((2- (2- ((N-ペンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)

HPLC躛定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.66分;

MAS.S \(\tilde{\tau} - \(\tilde{\text{P}} \) (ESI, Pos., 20V) : 611 (M + H) \(\tilde{\text{+}} \)

寒施例4 (826)

(N- ((2- (2- ((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

2 ニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3,5-ジメトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.69分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

奥施例4 (827)

フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 5-ジメトキシフェニル) エチ 3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

25

HPLC測定条件:A

20

ラ)アペノ)アロバン類

HPLC保持時間: 3.89分;

317

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+

実施例4 (828)

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェニ ラ) エチラ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)⁺,

5

実施例4 (829)

3- (N- ((2-(2-((ビリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3,5-ジメトキシ

フェニル) エチア) アミノ) プロパン感

2 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)+,

実施例4 (830)

20 フェニル) エチル) アミノ) プロバン極 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3, 5-ジメトキシ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.20分;

25 MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 568 (M + H) $^+$.

PCT/JP03/06678

ー2ーイル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン (3, 5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+

夹施例4 (832)

5 3- (N- ((2- (2- ((a-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3,5-ジメトキシフェニ

ラ) エチラ) アベノ) プロパン類

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+,

2

寒焔例4 (833)

3 - (N - ((2 - (2 - (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

エニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 5ージメトキシフェニル) エチル)

20 アペノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+,

25

3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - メトキッペンジルアペノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 5-ジメトキシフェ

リラ) エチノ) アミノ) プロパン類

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+

寒肺例4 (835)

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3,5-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ア) エチア) アペノ) プロパン類

5

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+,

ᅜ 寒焔例4 (836)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3,5-ジメトキシフェ 3- (N-((2-(2-((3-メトキシスンジラアミノ) カラボニラ)

ニル) エチル) アペノ) プロパン数

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間:3.78分;

MASS $\neq -$ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M + H) $^+$

実施例4 (837)

3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェニ

ア) エチル) アペノ) プロパン製

25

PCT/JP03/06678

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)+

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3, 5-ジメトキシフェ 3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

リア) エチル) アミノ) プロパン数

HPLC阅定条件:A

5 HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)+,

契施例4 (839)

(N- ((2- (2- ((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

2 エニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (3, 5-ジメトキシフェニ

ハ) エチハ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+,

20

実施例4 (840)

25

HPLC保持時間: 3.84分;

3 - (N - ((2 - (2 - ((N - メチル - N - ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3,5-ジメトキシ

フェニル) エチル) アミノ) プロパン感

HPLC浏定条件:A

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

実施例4 (841)

3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシ

フェニラ) エチラ) アミン) プロパン樹

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)⁺.

5

寒施例4 (842)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3, 5-ジメトキシ

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

2 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASS $\mathcal{T}-\mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H) $^+$

実施例4 (843)

20 フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((4- (tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3,5-ジメトキシ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.11分

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H) $^+$.

25

夷施例4 (844)

3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン殿

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+

寒施例4 (845)

10 3- (N- ((2-(2-(2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(3, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

MASS= - (ESI, Pos., 20V) : 585 (M + H) $^+$.

5

寒旋例4 (846)

3 - (N - ((2 - (2 - ((3 - フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3,5-ジメトキシフェ

20 ニル) エチル) アミノ) プロパン樹

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)⁺.

3 - (N - ((2 - (2 - (2, 5 - ジフルオロベンジルアミノ)カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.84分;

 $MASS\vec{7}-\beta$ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)⁺.

実施例4 (848)

3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシェチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2-

(3, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

10

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H) $^+$.

15 実施例4 (849)

3- (N- ((2- (2- ((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェニ

ラ) ドチラ) アミノ) プロパン類

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間:3.89分;

MASS = % (ESI, Pos., 20V) : $601 (M + H)^+$.

実施例4 (850)

3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) ガルボニル)

25 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (3, 5-ジメトキシフェ

ニア) エチア) アミノ) プロペン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+

與施例4 (851)

ニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸 3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 517 (M+H)+

3- (N-((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキ

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分

MASS $\mathcal{F} - \mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H) $^+$

20

爽施例4 (853)

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 5ージメトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((3-クロロベンジスアミノ) カルボニル) フ

エチラ) アミノ) プロスソ殴

HPLC测定条件:A

25

HPLC保持時間: 3.93分;

PCT/JP03/06678

寒施例4 (854)

MASS7-9 (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H) $^{+}$

3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(3, 5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン殻

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASS $\vec{\tau} - \phi$ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M + H)⁺.

5

実施例4 (855)

5ージメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン慰 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

寒施例4 (856)

20 メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3,5-ジ 3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

25 MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)⁺,

寒施例4 (857)

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 5ージメトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

奥施例4 (858)

5 アペノ) ノロバン酸 エニル) カルボニル) ーNー (2ー (3, 5ージメトキシフェニル) エチル) 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2- (2- (((3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,

HPLC测定条件:A

5 HPLC保持時間:3.53分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)⁺;

HPLC保持時間:3.67分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)+, 519,

20 寒施例4 (859)

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

25

HPLC保持時間: 3.88分 HPLC测定条件:A

ノ) エチン) アミノ) プロパン製

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)⁺。

エチル) アミノ) プロパン酸

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H) $^+$

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)+

HPLC保持時間:3.88分; HPLC測定条件:A シフェニル) エチル) アミノ) プロパン感

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3, 5-ジメトキ 3- (N- ((2- (2- ((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ 実施例4 (860)

5

<u> 実施例4 (861)</u>

N- (2- (3, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルビリジン-2

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.23分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 596 (M+H)+

実施例4 (862)

3- (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

ーN- (2- (3, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

20

HPLC保持時間: 3.47分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 638 (M+H)⁺。

25

実施例4 (863)

PCT/JP03/06678

3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - フェニルエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N - (2 - (3, 5 - ジメトキシフェニ

ア) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

<u> 実施例4 (864)</u>

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1-ナフチ

10 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2

ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.13分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)+

15

爽施例4 (865)

3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)

アミノ) カルポニル) フェニル) フェニル) カルポニル) ーN- (2- (2

ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間:3.78分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

寒肺例4 (866)

25 3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(2-エトキシフェニル) エチ

ア) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+, 489,

S

夷施例4 (867)

3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) エチル) ア

ハノ) アロバン酸

10 HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H) $^+$

15 3- (N-((2-(2-((1-十フチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 4.13分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)⁺,

奥施例4 (869)

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニ

25 万) エチア) アミノ) プロパン駅

HPLC測定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.36分;

MASS $\overrightarrow{\tau} - \cancel{\flat}$ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H) $^{+}$.

実施例4 (870)

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメテルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-エトキシフェニ

バ) エチバ) アベノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.31分;

5 MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)+,

実施例4 (871)

(N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリン

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-

(2ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

5

HPLC保持時間:4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+,

20 実施例4 (872)

3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーエトキシフェニル) エ

チラ) アペノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

25 HPLC保持時間: 4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+,

実施例4 (873)

3- (N- ((2-(2-((ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ ェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーエトキシフェニル) エチル) アミ

ノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

5 実施例4 (874)

エチラ) アベノ) プロパン顋 フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) 3- (N- ((2-(2-((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

2 HPLC保持時間:3.99分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

20 ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーエトキシフェニル) エ

チラ) アハノ) プロパン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.04分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

25

寒施例4 (876)

3- (N-((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーエトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

実施例4 (877)

3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーエトキシフェニル) エ

チル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+

5

寒施例4 (878)

3- (N- ((2- (2- ((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-エトキシフェニル)

 エチバ)アベノ) プロパン暦

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASS $\vec{\tau} - \theta$ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)⁺

夹施例4 (879)

25 3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-エトキシフェニル) エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+。

実施例4 (880)

3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-エトキシフェニ

ラ) エチラ) アミノ) プロパン感

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)⁺,

5 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-エトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ラ) エチラ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.04分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)+

20

実施例4 (882)

3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ペンジルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -NI (2- (2-エトキシフェニ

25 万) エチラ) アベノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 4.24分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+

寒施例4 (883)

3- (N- ((2-(2-((4-(tert-プチル) ベンジルブミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニ

ラ) メチラ) アペノ) プロバン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.28分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+

5

夹施例4 (884)

3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

ノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エ

HPLC测定条件:A

 \simeq

トキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.79分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)⁺。

20 奥施例4 (885)

3- (N- ((2- (2- ((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーエトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.97分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H) $^+$.

実施例4 (886)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-エトキシフェニル) 3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.99分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)+

5 実施例4 (887)

コア) エチア) アミノ) プロパン酸 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-エトキシフェ 3- (N- ((2-(2-(2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

HPLC測定条件:A

15 HPLC保持時間:4.00分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+

奥施例4 (888)

3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ

20 チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-

(2-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{\vartheta}$ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)⁺,

25

夷施例4 (889)

チラ)アミノ)プロパン製 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-エトキシフェニル) エ 3- (N-((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+

夹施例4 (890)

3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

5 フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーエトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)+

夷施例4 (891)

ᅜ

3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

ニル) カルボニル) ーNー(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)

レロスソ類

6 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 501 (M+H)+

25 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-エトキシフェ 3- (N-((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+

実施例4 (893)

3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーエトキシフェニル) エ

チラ) アペノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間:4.10分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+.

寒焔例4 (894)

7 チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-3-(N-((2-(2-(2ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 (((15) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分;

20 MASS $\mathcal{F}-\mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H) $^{+}$

実施例4 (895)

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2 3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

ーエトキシフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸

25

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H) $^{+}$

3- (N- ((2- (2- (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキ

シフェニア) エチア) アミノ) プロパン感

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 4.06分;

10 MASS $\vec{\tau} - \phi$ (ESI, Pos., 20V) : 583 (M+H)⁺.

3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - チェニルメチルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2-エトキシフェニル) エ

チラ)アベノ) プロペン数

7

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.95分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

20 実施例4 (898)

3- (N- ((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2,

3、4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ

エニル) カルボニル) -N-(2-(2-エトキシフェニル) エチル) アミ

ノ) アロパン酸

25 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.66分;

736:温检柱的719日

VO 03/099765

HPLC保持時間:3.82分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M + H)+

実施例4 (899)

3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) エ

チル) アペノ) プロペン酸

HPLC測定条件:A

10 HPLC保持時間: 4.04分;

MASS F-9 (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

3- (N- ((2- (2- ((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-エトキシフェ

ニラ) エチラ) アミノ) プロパン酸

2

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.04分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+

20

夷施例4 (901)

3- (N- ((2- (2- ((N-メヂバーN- (6-メヂバブジン-2

ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

NI(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロバン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間:3.36分;

339

VVO 03/099765

PCT/JP03/06678

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)+

爽施例4 (902)

ル) - N - ベンジルアペノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) (N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.58分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H)+

5

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) エ 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

チル) アミノ) プロパン酸

2

HPI.C测定条件:A

HPLC保持時間: 4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

寒焔例4 (904)

20 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3

HPLC测定条件:A

ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:4.08分

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)+,

25

寒焔例4 (905)

アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3 3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル) ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン畷

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.75分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)+

実施例4 (906)

5 3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ ラ) アベノ) プロパン要 ニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーエトキシフェニル) エチ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+,

5

寒施例4 (907)

フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーエトキシフェニル) エチル) ア 3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

バノ) プロパン製

HPLC測定条件:A

20

HPLC保持時間:4.00分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H) $^+$.

23 奥施例4 (908)

3- (N- ((2- (2- ((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

7000/8

PCT/JP03/06678

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エ

ヤラ) アペノ) プロパン要

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)+,

寒施例4 (909)

3-(N-((2-(2-((ビリジン-2-イルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3-エトキシフェニ

10 万、 メチア)アッノ) プロパン暦

HPLC巡院条件:A

HPLC保持時間:3.33分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H) $^+$.

15 实施例4 (910)

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニ

ハ) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.25分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : SS2 (M+H) $^+$.

寒施例4 (911)

3-(N-((2-(2-((1, 2, 3, 4-7+7+7+7+7+7))

25 - 2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

WO 03/099765

HPLC測定条件:A HPLC保持時間:3.97分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+,

実施例4 (912)

3- (N- ((2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

10 HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+,

実施例4 (913)

3- (N- ((2-(2-(ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

15 ェニル)カルボニル)-N- (2+ (3-エトキシフェニル)エチル)アミノ) プロパン概・

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.91分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

20

寒施例4 (914)

3- (N-((2-(2-((2-メトキツベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

奥施例4 (918)

PCT/JP03/06678

MASS $\mathcal{F}-\mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H) $^+$.

3- (N- ((2- (2- ((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

チル) アミノ) プロパン酸 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

5

3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-エトキシフェニル)

エチハ) アミノ) プロパン製

2

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASS \mathcal{F} - \mathcal{P} (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H) $^+$.

奖施例4 (917)

20 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エ 3- (N- ((2- (2- ((4-クロロベンジトアミノ) カルボニル) フ

チェラ アペノ) プロパン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 4.04分;

25 MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)⁺,

エチハ) アミノ) プロパン製 フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーエトキシフェニル) 3- (N-((2-(2-((4-メトキウベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

5 チバ) アペノ) プロパン数 3- (N- ((2-(2-((4-メデルベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.99分;

5 MASS $\overrightarrow{\tau} - \cancel{\sigma}$ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M + H)⁺,

奥施例4 (920)

3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフェニ

グ) エチグ) アベノ) プロパン酸

20

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{>}$ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)⁺

25 **奥施例4 (921)**

3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

PCT/JP03/06678

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-エトキシフェニ

ハ) エチハ) アペノ) プロハン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)+

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフェニ 3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

5 ア) エチア) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.19分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)⁺,

5 実施例4 (923)

(N- ((2-(2-((4-(tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ハ) エチル) アミノ) プロパン製 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフェニ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.22分

20

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H) $^{+}$

実施例4 (924)

3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

23 /) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エ

トキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASS $\overrightarrow{\tau} - \cancel{\vartheta}$ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M + H)⁺.

<u> 実施例4 (925)</u>

エチバ) アミノ) プロバン数 フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーエトキシフェニル) 3- (N-((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間: 3.91分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{\sigma}$ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H) $^{+}$.

実施例4 (926)

3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

2 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン製

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)⁺。

実施例4 (927)

20

ニゾ) エチゾ) アミノ) プロバン数 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェ 3- (N- ((2-(2-(2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

23 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+

実施例4 (928)

3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー

(3ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

5

夷施例4 (929)

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エ

チラ) アッノ) プロパン環

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+,

20 3- (N-((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-エトキシフェニル)

メチバ) アペノ) プロパン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.91分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)+

実施例4 (931)

ニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ **ルロベソ**要

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASS $\vec{\tau}-\vec{r}$ (ESI, Pos., 20V) : 501 (M+H) $^+$

奥施例4 (932)

5 **リラ) エチル) アミノ) プロパン製** ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェ 3- (N-((2-(2-((2, 6-ジファギロベンジァアミノ) カアボ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

2 MASS $\vec{\tau} - \theta$ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M + H) $^+$

寒脑例4 (933)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エ 3- (N-((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

チラ) アッノ) プロパン酸

20

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.04分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)+

25

3- (N- ((2- (2- (((1S) -1-フェニルー2-ヒドロキシエ

VAO 03/099765

PCT/JP03/06678

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン数

HPLC测定条件:A

寒肺例4 (935)

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3 3- (N- ((2-(2-(((1R)-1-(4-メチルフェニル) エチ

5 ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)+,

15 寒肺例4 (936)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキ (N- ((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

シフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC巡炕条件:A

20 HPLC保持時間: 3.99分

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 583 (M+H) $^+$

3- (N- ((2-(2-((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フ

25 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーエトキシフェニル) エ チバ) アベノ) プロバン製

HPLC保持時間: 3.73分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+

<u> 実施例4 (938)</u>

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 557 (M + H) $^{+}$

HPLC保持時間: 3.88分; HPLC測定条件:A

エニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミ 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N-((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, ノ)レロバン要

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASS 7-4 (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.77分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)⁺,

5

寒焔例4 (939)

チル) アミノ) プロパン類 エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (3-エトキシフェニル) エ 3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A

20

HPLC保持時間: 3.97分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

寒施例4 (940)

25 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフェ 3- (N- ((2- (2- ((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

リラ) メチラ) アミノ) プロバン製

HPLC 河 C 条件: A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)+

<u> 実施例4 (941)</u>

N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

HPLC測定条件:A

ಠ

HPLC保持時間: 3.33分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pas., 20V) : 580 (M+H)⁺,

奥施例4 (942)

2 3- (N- ((2-(2-((N-(2-(N, N-ジメチルアミノ) エチ -N-(2-(3-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸 ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.53分;

20 $MASS \mathcal{F} - \mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 622 $(M+H)^+$

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーエトキシフェニル) エ 3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

チェン アミノ)プロパン酸・

25

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.97分;

WO 03/099765

MASS $\vec{\tau}-\beta$ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)⁺.

実施例4 (944)

ェニアプロアグ) アベノ) プロバン酸 **ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フ** 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.06分;

5 MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)⁺,

実施例4 (945)

3- (N-((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(3-フェ

5 **コップログラ)アミノ) プロバン駅**

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H) $^+$.

20 **実施例4 (946)**

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

プロスソ製

HPLC测定条件:A

23 HPLC保持時間:4.04分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+

3- (N- ((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

PCT/JP03/06678

実施例4 (947)

3- (N- ((2- (2- ((ビリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

HPLC保持時間:4.02分;

HPLC測定条件:A

プロスツ酸

MASS 7-8 (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+,

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

õ

3- (N- ((2-(2-((a-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5

ルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (3ーフェニルプロビ

3- (N- ((2-(2-((N-インプロビル-N-ベンジルアミノ) カ

実施例4 (951)

2 HPLC保持時間: 3.97分;

夷施例4 (949)

6

25

奥施例4 (950)

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) ア

ペノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.33分;

寒施例4 (948)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

HPLC测定条件:A

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+,

ハノ) プロバン酸

2

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{\phi}$ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)⁺

HPLC保持時間:4.06分; HPLC測定条件:A ラ)アミノ)プロパン数

<u> 実施例4 (952)</u>

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル) ア 3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC測定条件:A

20

HPLC保持時間:3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+,

実施例4 (953)

25 3- (N- ((2- (2- ((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) ア

PCT/JP03/06678

ルノ) レロスソ際

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.19分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+

爽施例4 (954)

3- (N- ((2-(2-((4-(tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル)ア

ハノ) プロパン酸

5 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 4.19分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)⁺。

<u> 実施例4 (955)</u>

5 3- (N- ((2-(2-((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

ノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N- (3-フェニル

ノロアラ)アルノ) ノロバン殴

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

20 MASS= 9 (BSI, Pos., 20V) : 565 (M+H) $^+$

3- (N-((2-(2-((2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル)

アミノ) プロバン殴

25

HPLC测定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.93分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

実施例4 (957)

3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ チルアミノ) カルボコル) フェコル) フェコル) カルボコル) ーNー (3ー

フェニップロピッ) アミノ) プロパン感

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

-0 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

実施例4 (958)

3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

15 レロスン概

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+,

20 寒施例4 (959)

3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間:4.02分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+,

VO 03/099765

突旋例4 (960)

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (3-3- (N- ((2- (2- (((1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.73分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

5

メニハプロパハ) アミノ) プロパン顋 ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (3-フ 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-(4-メチルフェニル) エチ

HPLC阅定条件:A

5 HPLC保持時間:4.06分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

3- (N- ((2- (2- ((1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

20 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(3-フェニルプロ

アラ) アペノ) ノロパン母

HPLC阅定条件:A

実施例4 (963)

要施例4 (962)

HPLC保持時間: 3.99分;

MASS 7-4 (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)+

25

PCT/JP03/06678

3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ 3- (N- ((2- (2- (((3S) -3-ヒドロキシメチルー1, 2, ェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件:A

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+;

HPLC保持時間: 3.62分;

HPLC保持時間: 3.75分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)+, 473.

5

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ アロバン酸

HPLC測定条件:A

ij HPLC保持時間: 3.97分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+.

実施例4 (965)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2

ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー

20

N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.31分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)+,

25

夷施例4 (966)

PCT/JP03/06678

(N- ((2- (2- ((N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)

- N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間:3.55分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)⁺.

奥施例4 (967)

3-(N-((2-(2-((1, 2, 3, 4-7)))))

5 ハアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジ

ア) アペノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 533 (M+H)+

奥施例4 (968)

5

3- (N- ((2-(2-((N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)

アハノ) カフボニラ) フェニラ) フェニラ) カフボニア) -N- (ベンジラ)

アミノ) プロパン酸

20 HPLC 回定条件:A

HPLC保持時間:3.60分

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+

奥施例4 (969)

25 3 - (N - ((2 - (2 - ((1 - ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ヘンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+

実施例4 (970)

3- (N- ((2- (2- ((α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ベンジル)アミノ)プロバン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.84分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)+

実施例4 (971)

3- (N- ((2-(2-((2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(ベンジル)アミノ)プロバン樹

HPLC測定条件:A

2

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)+,

実施例4 (972)

20 3- (N-((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) レ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ベンジル) アミノ) プロバン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+,

25

実施例4 (973)

PCT/JP03/06678

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパ 3- (N- ((2- (2- ((N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)+

夹施例4. (974)

3- (N- ((2-(2-((N-プチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

5 /P) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ベンジル) アミノ) プロバ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

5

夷施例4 (975)

3- (N- ((2-(2-((4-(tert-プチル) ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ペンジル) アミノ) プロバ

20 HPLC遊浜条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H) $^+$

寒施例4 (976)

25 3- (N- ((2- (2- ((1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ ノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(ベンジル)ア

ハノ) ノロスン窓

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.60分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)+

寒施例4 (977)

よソ概 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (ベンジル) アミノ) プロ 3- (N- ((2-(2-(2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)+,

実施例4 (978)

5 ジラ) アミノ) ノロスン要 **チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (ベン** 3- (N- ((2-(2-(((1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.56分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)⁺。

寒施例4 (979)

メニク) フェニル) カアボニア) -N-(ベンジラ) アハノ) プロベン酸 3- (N- ((2-(2-((2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

PCT/JP03/06678

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+

3- (N- ((2-(2-((3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

S ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ペンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+

5 **実施例4 (981)**

チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベン 3- (N- ((2-(2-(((1S)-1-フェニルー2-ヒドロキシエ

ジル) アペノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

7 HPLC保持時間:3.58分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)+

夷施例4 (982)

3- (N- ((2- (2- (((1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

20 **ルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(ベンジ**

ア) アペノ) プロパン恩

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)+

25

夷施例4 (983)

プロパン酸 カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((1-(4-フルオロフェニル) エチルアミノ)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)+.

<u> 実施例4 (984)</u>

3- (N-((2-(2-(((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2,

5 3, 4ーテトラヒドロインキノリンー2ーイル) カルボニル) フェニル) フ ェニル) カルボニル) ーNー(ベンジル)アミノ) プロバン樹

HPLC密定条件:A

HPLC保持時間: 3.49分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+;

2 HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+, 445.

20 ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ー 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N- (6-メチルビリジン-2

NI (ベンジラ) アッノ) プロベン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)⁺, 508,

25

寒施例4 (986)

PCT/JP03/06678

ル) -N-ベンジアアミノ) カアボニル) フェニル) フェニル) カアボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロベン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.40分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)+,

寒施例4 (987)

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

10 ル) ー4ーメチルフェニル) ー5ーメチルフェニル) カルボニル) ーNー (2

ー (4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン畷

HPLC測定条件:B

HPLC保持時間:3.59分;

MASSF-9 (ESI, Pos.) : 580 (M+H)+, 472.

15

夹施例4 (988)

3- (N- ((2- (2- ((1-メチル-3-フェニルプロピルアミノ)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (3-メトキ

ツフェニラ) ドチラ) アミノ) プロベン圏

20 HPLC逆烷條年:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASS= - (ESI, Pos., 20V) : 579 (M + H) $^+$

夹施例4 (989)

25 3- (N- ((2- (2- (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) -4-メチルフェニル) -5-メチルフェニル) カルボニル) -N- (2-

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

(4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:B

HPLC保持時間:4.53分;

MASS $\mathcal{F} - \mathcal{P}$ (ESI, Pos.) : 597 (M+H) $^{+}$, 525 $_{\circ}$

S

実施例4 (990)

3-(N-((2-(2-((1-メチル-3-フェニルプロピルアミノ)

カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルエチ

ア) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

実施例4 (991)

15 3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(3-メトキシフェニル) エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.69分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+

実施例4 (992)

3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) ア

25 ミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

PCT/JP0J/06678

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)⁺•

夹施例4 (993)

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (3-メトキシフェニ

ハ) エチハ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.23分:

5 MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)⁺。

寒焔例4 (994)

3- (N- ((2- (2- ((ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (3ーメトキシフェニ

ラ) エチル) アミノ) プロパン酸

7

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H) $^{+}$.

20 **奥施例4 (995)**

3- (N- ((2- (2- (ピリジン-4-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニ

ラ) エチラ) アペノ) プロパン製

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.2分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+.

WO 03/099765

実施例4 (996)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-デトラヒドロインキノリン ー 2 ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2-

(3ーメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)+.

5

実施例4 (997)

ェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミ

3- (N- ((2-(2-((ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

ノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

ᅜ HPLC保持時間:3.8分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{\phi}$ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H) $^{+}$

実施例4 (998)

3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

20 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

MASS $\vec{\tau}-\vec{p}$ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H) $^{+}$.

25

寒肺例4 (999)

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+。

実施例4 (1000)

3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

10 ェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシフェニル)エ

チル) アミノ) プロバン数

HPLC浏定条件:A

HPLC保持時間:3.88分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

爽施例4 (1001)

5

3 - (N - ((2 - (2 - ((N - メチル - N - ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルポニル) -N-(2-(3-メトキシフェニ

ア) エチア) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

裏施例4 (1002)

25 3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(3-メトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASS $\overrightarrow{\tau}-\phi$ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)⁺,

y.

3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルポニル) フェニル) フェニル) カルポニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC测定条件: A

HPLC保持時間:3.82分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M + H) $^{+}$

実施例4 (1004)

12 3- (N- ((2-(2-(アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.64分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 995 (2M+Na)+, 487 (M+H)+

実施例4 (1005)

3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(3-メトキシフェ

25 ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件: A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)⁺。

奥施例4 (1006)

3 - (N-((2-(2-((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+。

5

奥施例4 (1007)

3-(N-((2-(2-((2-フリルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)

アロベン酸

5

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.03分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 967 (2M+H) $^+$, 484 (M+H) $^+$.

20 实施例4 (1008)

3- (N- ((2- (2- (1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) プロ

よソ思

HPLC阅定条件:A

25 HPLC保持時間:3.20分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 520 (M + H) $^+$.

700m・間相割的 10m

実施例4(1012)

実施例4 (1009)

3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (ビリ

ジンー3ーイアメチア) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.21分;

MASS F-9 (ESI, Pos., 20V) : 520 (M+H)+

10 実施例4 (1010)

3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) ア

ハノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

15 HPLC保持時間:3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)+。

寒施例4 (1011)

3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (ピリジン-3-イルメチル) ア

ハノ) プロスソ酸

20

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)+

25

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2- (2- ((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(ビリジン-3-イルメチル)ア

ハノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.09分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)+

夷施例4 (1013)

3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

5 ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミ

ノ) レロバン欧

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)+。

爽施例4 (1014)

5

3- (N- ((2- (2- ((N-メチルーN-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル)

アペノ) プロパン殴

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.20分

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)+.

25 フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) ア 3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

WO 03/099765

PCT/JP0J/06678

ハノ) アロスン暦

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.10分;

MASST-9 (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)+.

実施例4 (1016)

3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (ピリジンー3-イルメチル) ア

ベノ) プロスン酸

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)+

15 3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ピリジンー3ーイルメチル) ア

ハノ) プロパン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.12分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)+,

<u> 実施例4(1018)</u>

3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ ニル) カルボニル) ーNー(ピリジンー3ーイルメチル)アミノ)プロバン

23

HPLC测定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 2.94分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 887 (2M+H)⁺, 444 (M+H)⁺

実施例4 (1019)

コル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチ 3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC遺伝条件:A

HPLC保持時間:3.11分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 530 (M+H)+

5

夹施例4 (1020)

3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーN- (ピリジンー3-イルメチル) アミ

ノ) レロパン酸

2

HPLC阅定条件:A

HPLC保持時間: 3.09分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 500 (M+H)+,

20 **奥施例4 (1021)**

フェニル) カルボニル) ーNー (2- (ピリジンー2ーイル) エチル) アミ 3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

ノ) プロパン酸

HPLC保持時間: 3.20分;

377

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)+,

HPLC测烷条件:A

PCT/JP03/06678

與施例4 (1022)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-2-イル) 3- (N- ((2-(2-((ビリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:2.72分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)⁺, 255,

5 **奥施例4 (1023)**

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-2-イル) 3- (N- ((2-(2-((ビリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

5 HPLC保持時間:2.72分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)+, 255,

奥施例4 (1024)

3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン

20 ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー

(アリジソー2ーイル) エチル) アミノ) プロバン数

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)⁺。

25

実施例4 (1025)

PCT/JP03/06678

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-2-イル)エ 3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

チラ) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.13分;

MASS $\mathcal{F}-\mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)⁺.

实施例4 (1026)

3- (N- ((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

5 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-2-イル)エ

チル)アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A·

HPLC保持時間: 3.11分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H).

裏施例4 (1027)

5

3 - (N - ((2 - (2 - ((4 - メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-2-イル)エ

チラ) アミノ) プロスン数

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+

突施例4 (1028)

25 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-2-イル)エチ

3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

HPLC測定条件:A ラ) アペノ) プロパン製

HPLC保持時間: 3.20分;

MASS $\mathcal{F}-\mathcal{F}$ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H) $^{+}$

実施例4 (1029)

エチル) アミノ) プロパン酸 ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-2-イル) 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

実施例4 (1030)

2 3- (N- ((2- (2- ((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) チル) アミノ) プロパン数 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (ピリジンー2-イル) エ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.12分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)+

20

実施例4 (1031)

3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNI (2- (ピリジンー2-イル) エ

25 **チラ)アミノ) プロバン**酸

HPLC測定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.14分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H) $^{+}$

3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-2-イル)エ

チル) アペノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.14分;

<u></u> MASSF-# (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)+

夹施例4 (1033)

3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

ニル) カルボニル) ーNー(2-(ピリジンー2-イル)エチル)アミノ)

15

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 2.94分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 458 (M+H)+

20 寒施例4 (1034)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-2-イ 3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ハ) エチハ) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

25

381

HPLC保持時間: 3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)+,

PCT/JP03/06678

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-2-イル) エチ 3- (N- ((2-(2-((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フ

ル) アミノ) プロパン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.09分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 514 (M+H)

5 寒焔例4 (1036)

ル) エチル) アミノ) プロパン酸 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(ピリジン-2-イ 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

HPLC測定条件:A

2 HPLC保持時間:3.18分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H) $^{+}$.

実施例4 (1037)

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エチ

ハ) アミノ) プロパン数

20

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+,

25

実施例4 (1038)

PCT/JP03/06678

ニル) フェニル) カルボニル) ーNー (1ーメチルー3ーフェニルプロピル) 3- (N- ((2- (2- ((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)+

夹施例4 (1039)

3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

5 フェニル) カルボニル) ーN-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミ

ノ)レロスソ限

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.02分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)+

夷施例4 (1040)

2

(N- ((2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニル

プロアン)アミノ)プロバン母

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.38分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)⁺•

與施例4 (1041)

25 3- (N- ((2- (2- ((ビリジンー3-イルメチルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニル

ソロアラ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.27分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)*

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (1ー 3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン

メチルー3ーフェニルプロピル) アミノ) プロバン酸

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.00分;

MASS $\overrightarrow{\tau} - \cancel{\sigma}$ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H) $^+$

2 プロバン酸 3- (N- ((2-(2-(ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ ェニル) カルボニル) ーNー(1ーメチルー3ーフェニルプロピル)アミノ)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.93分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)⁺。

<u> 実施例4 (1044)</u>

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フェニルプロ 3- (N- ((2-(2-((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

25 アラ) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+。

寒施例4 (1045)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(1-メチル-3-フェニルプロ 3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

アル) アペノ) プロパン窓

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MAS·Sデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

5

夹施例4 (1046)

3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(1-メチル-3-フェニルプロ

アラ)アベノ)アロバン数

2

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASST-9 (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)+

20 実施例4 (1047)

3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (1ーメチルー3ーフェニルプロピ

ア) アミノ) アロバン暦

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.00分

25

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

実施例4 (1048)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニル 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

プロアラ) アペノ) プロパン類

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.99分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)+

5 寒施例4 (1049)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(1-メチル-3-フェニルプロ 3- (N-((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

アル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

2 HPLC保持時間: 3.97分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)+

3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(1-メチル-3-フェニルプロ

ピル) アミノ) プロパン酸

20

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASS $\mathcal{F}-\mathcal{P}$ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M + H)⁺.

25

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

ニル) カルボニル) ーNー (1ーメチルー3ーフェニルプロピル) アミノ)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 485 (M+H)+

夹施例4 (1052)

3- (N-((2-(2-(2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニ

アプロアル)アルノ)プロバン製

HPLC盥烷条件:A

HPLC保持時間:3.93分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)+.

5

寒施例4 (1053)

3- (N- ((2- (2- ((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(1-メチル-3-フェニルプロピ

ラ) アベノ) プロバン概

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+

实施例4 (1054)

25 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフェニル) 3- (N-((2-(2-((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

実施例4 (1055)

3- (N- ((2-(2-((3-メトキウベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.84分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

実施例4 (1056)

5 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メトキシフェニル) 3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.82分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+

実施例4 (1057)

3- (N- ((2- (2- ((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー(2ー(2ーメトキシフェニル) エ

25 チル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.93分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)⁺.

夷施例4 (1058)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (2- (2-メトキシフェニ 3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-ペンジルアミノ) カルボニ

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M + H) $^+$, 537 $_\circ$

5

寒施例4 (1059)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフェニル) 3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

5 エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H) $^{+}$

20 **爽施例4 (1060)**

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メトキシフェニル) 3 - (N - ((2 - (2 - ((3 - フルオロベンジルアミノ) カルボール)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

25 HPLC保持時間:3.89分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)+.

389

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

実施例4 (1061)

ニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メトキシフェニル) エチル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

アロベン類

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.69分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 487 (M+H).

5 寒施例4 (1062)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2-メトキシフェ 3- (N- ((2- (2- ((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

15 HPLC保持時間: 3.95分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H).

実施例4 (1063)

3ー(N-((2-(2-((2-フェニルエチルアミノ)カルボニル)フ

エニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2ーメトキシフェニル) エ

チラ)アミノ)プロバン酸

20

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+.

25

寒施例4 (1064)

VVO 03/099765

PCT/JP03/06678

3-(N-((2-(2-((2-フリルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ビリジン-4-イル)エチル)

アペノ)プロパン恩

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.01分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 498 (M+H)⁺。

夹施例4 (1065)

3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

10 フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミ

ノ)ノロバン恩

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)+, 418。

15

爽施例4 (1066)

3- (N- ((2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル)

エチル) アベノ) プロパン酸

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 2.70分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)+, 255。

寒施例4(1067)

25 3 - (N - ((2 - (2 - ((1, 2, 3, 4 - テトラヒドロインキノリン - 2 - イハト) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N - (2 -

(ピリジンー4ーイル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)+

•

実施例4 (1068)

3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC保持時間:3.12分;

HPLC测定条件:A

5

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)+

実施例4(1069)

15 3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ビリジンー4-イル) エ

HPLC測定条件:A

チル) アミノ) プロバン酸

HPLC保持時間:3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+II)+

20

実施例4 (1070)

3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-(ピリジンー4-イル) エ

25 チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.09分;

MASS $\vec{\tau}$ - ϕ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)⁺.

実施例4 (1071)

3- (N- ((2-(2-((4-メチルペンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-4-イル)エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.16分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{\phi}$ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H) $^{+}$

5

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-4-イル) 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ペンジルアミノ) カルボニ

エチル) アミノ) プロパン酸

ᅜ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.16分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H).

20 夷施例4 (1073)

ニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-4-イル)エチル)アミノ) 3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

HPLC测定条件:A

25 HPLC保持時間: 2.92分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 915 (2M+H) $^{+}$, 458 (M+H) $^{+}$

実施例4 (1077)

25

実施例4 (1074)

3- (N-((2-(2-((2, 6ージフルオロベンジルアミノ) カルボ ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-4-イ

ハ) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.09分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)+, 272.

70 実施例4 (1075)

ル) エチル) アミノ) プロパン酸 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (ピリジンー4ーイ 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

HPLC测定条件:A

2 HPLC保持時間:3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)⁺。

実施例4 (1076)

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

20 ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(ピリジン-4-イル)エチ

ル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.14分;

MASS = -9 (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)⁺, 261.

PCT/JP03/06678

フェニル) カルボニル) ーNー (2ーフェニルエチル) アミノ) プロバン酸 3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.89分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 533 (M+H) $^+$

実施例4 (1078)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルエチル)アミ 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

5 ノ) ノロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.18分;

MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)⁺.

5 寒施例4 (1079)

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2-3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン

HPLC湖定条件:A

フェニルエチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC保持時間:3.86分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 533 (M+H)⁺.

寒施例4 (1080)

3- (N- ((2-(2-((2-メトキウベンジアアミノ) カルボール)

25 フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ)

レロスソ概

HPLC保持時間: 3.84分;

HPLC測定条件:A

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{>}$ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)⁺.

夹施例4 (1081)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルエチル) アミノ) 3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

プロバン酸

5 HPLC保持時間:3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)*

実施例4 (1082)

3- (N- ((2- (2- ((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

5 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル) アミノ)

HPLC测定条件:A

アロスツ酸

HPLC保持時間: 3.78分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{9}$ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H) $^{+}$.

20

寒施例4 (1083)

3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル) アミノ) ブ ロバン酸

HPLC測定条件:A

25

HPLC保持時間: 3.91分;

PCT/JP03/06678

MASS 5-4 (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H).

実施例4 (1084)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミ 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ノ) アロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)⁺.

奥施例4 (1085)

5

プロバン概 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルエチル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC测定条件:A

2

HPLC保持時間:3.86分;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)+,

寒施例4 (1086)

20 フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル) アミノ) 3- (N- ((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

ルロスソ製

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

25

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)

実施例4 (1087)

ニル) カルボニル) ーN-(2-フェニルエチル)アミノ)プロバン酸 3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 457 (M+H)+

3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

5 ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) ア ハノ) プロスン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)+.

5

実施例4·(1089)

3- (N- ((2- (2- ((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル)アミノ)プ

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 513 (M+H)+

実施例4 (1090)

25

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) 3- (N- ((2-(2-((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

4.

PC17JP03/06678

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC浏定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : $567 (M+H)^+$

與施例4 (1091)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(4-メトキシフェニル) 3- (N- ((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

エチル)アミノ)プロバン殴

HPLC測定条件:A

5

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)⁺.

突施例4 (1092)

2 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-メトキシフェニル) 3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.75分;

20 MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)+.

夹施例4 (1093)

3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

25

HPLC测定条件:A

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーメトキシフェニル) エ

チル) アミノ) プロパン酸

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間:3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

実施例4 (1094)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (4-メトキシフェニ

ル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A HPLC保持時間:3.80分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)⁺。

実施例4 (1095)

3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル)

5 エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.80分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H) $^{+}$

20 実施例4 (1096)

3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

ニル)カルボニル)-N-(2-(4-メトキシフェニル)エチル)アミノ)

レロベン要

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.60分;

MASS $\neq -$ (ESI, Pos., 20V) : 487 (M+H) $^{+}$.

实施例4 (1097)

フェニル) カルボニル) ーNー(2-(2,4-ジクロロフェニル) エチル) 3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.15分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)+

爽施例4 (1098)

5

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 4-ジクロロフ 3- (N- ((2- (2- ((ビリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

エニハ) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC浏定条件:A

HPLC保持時間:3.34分;

2

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)+.

(N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン

20 ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー

(2, 4ージクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.10分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)

25

PCT/JP03/06678

WO 03/099765

PCT/JP03/06678

3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,4-ジクロロフェニ

ル) エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 605 (M+H).

奥施例4 (1101)

3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

5 フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (2, 4ージクロロフェニ

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 4.06分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 605 (M+H)⁺.

2

実施例4 (1102)

エニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(2,4-ジクロロフェニル) 3- (N- ((2- (2- ((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:4.13分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H)+.

実施例4 (1103)

25 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフ

<u>401</u>

PCT/JP03/06678

ェニル) エテル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H)+

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 4-ジクロロフェニ 3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC酒定条件:A

5

HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)+。

5 3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ ニル) カルボニル) ーNー (2ー (2, 4ージクロロフェニル) エチル) ア

ハノ)アロパン母

HPLC巡院条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

20 MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)⁺

寒焔例4 (1106)

3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロペンジルブミノ) カルボ

フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25

HPLC测定条件:A

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロ

HPLC保持時間:4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)+,

実施例4 (1107)

3- (N- ((2- (2- ((2-チェニルメチルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2- (2, 4-ジクロロフェニル)

エチル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:4.04分;

5 MASS $\vec{\tau}$ - θ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H) $^{+}$

実施例4 (1108)

3- (N- ((2-(2-((2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

ニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-エトキシフェニル)エチ

5 ブ) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASS = + (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)+

20

3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル)エチル)ア

ハノ) ピロスソ酸

HPLC测定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.99分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H).

404

PCT/JP03/06678

- 2 - イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 -3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン

5

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル) 3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

2

夹施例4 (1112)

3- (N- ((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

20 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-エトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.87分;

25

寒焔例4 (1113)

MASSF-> (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+.

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)⁺, HPLC保持時間:3.93分; HPLC测定条件:A MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)+ HPLC保持時間:3.91分; エチル) アミノ) プロバン酸 寒施例4 (1111) HPLC遊院条件:A (4ーエトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

実施例4 (1114)

HPLC保持時間: 3.99分;

HPLC測定条件:A チン)アペノ)プロパン数 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル) エ 3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル)

MASS $\neq -9$ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H) $^+$

3- (N- ((2-(2-((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニ ラ) エチラ) アミノ) プロパン酸

5

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASS= 9 (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H) $^+$

5

実施例4 (1115)

3- (N-((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)+

実施例4 (1116)

25 3- (N- ((2-(2-((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (2ー (4ーエトキシフェニル)

6

PCT/JP03/06678

エチァ) アペノ) プロベン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASS = -4 (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H).

実施例4 (1117)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル) 3- (N-((2-(2-((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC保持時間:3.89分;

15 ニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル) エチル) アミノ)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(2-(4-エトキシフェ 3- (N- ((2- (2- ((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

25

407

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

5

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H) $^{+}$

夹施例4 (1118)

3- (N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 501 (M+H)⁺。

HPLC測定条件:A

コア) エチア) アミノ) プロバン慰

WO 03/099765

HPLC保持時間: 3.88分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - \cancel{p} (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H) $^{+}$.

実施例4 (1120)

3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - チェニルメチルアミノ) カルボニル) フ ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-エトキシフェニル)エ

チル) アミノ) プロパン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)*。

実施例4 (1121)

フェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル)アミノ)プロバン 3- (N- ((2- (2- ((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

15

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+.

20 寒焔例4 (1122)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル)ア 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間: 3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)+

NO 03/099765

PCT/JP03/06678

夹施例4 (1123)

ー 2 ー イル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(3-3- (N- ((2-(2-((1, 2, 3, 4ーテトラヒドロインキノリン

HPLC遺伝条件: A

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)+。

5

ェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2-(2-(ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

HPLC保持時間:3.89分;

3- (N- ((2-(2-((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル) アミノ)

20 ノロベン酸

HPLC保持時間:3.89分;

25 夹施例4 (1126)

409

フェニップロアル) アッノ) プロパン感

HPLC保控時間: 3.95分;

寒馗例4 (1124)

HPLC测定条件:A

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)⁺。

HPLC迥定条件:A

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)⁺.

3- (N- ((2-(2-((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロアル)アミノ)

プロスン数

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

実施例4 (1127)

3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル) アミノ)

5 プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASS 7-9 (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)+

2 寒施例4 (1128)

3- (N- ((2-(2-((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

ェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (3ーフェニルプロピル) アミノ)

プロスン酸

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)+,

奥施例4 (1129)

3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ペンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (3ーフェニルプロピル) ア

ハノ) アロバン酸

VAO 03/099765

PCT/JP03/06678

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.93分;

MASS $\overrightarrow{\tau}$ - $\cancel{\phi}$ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)⁺.

奥施例4 (1130)

3 - (N - ((2 - (2 - ((2 - フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

5

5

夷施例4 (1134)

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル)

3- (N- ((2- (2- ((2, 6ージフルオロベンジルアミノ) カルボ

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 963 (2M + Na) $^{+}$, 471 (M + H) $^{+}$.

HPLC保持時間:3.73分; HPLC測定条件:A ニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル)アミノ)プロバン酸 3- (N- ((2- (2- ((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

実施例4 (1133)

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+,

2 フェニル) フェニル) カルボニル) ーN-(3-フェニルプロピル) アミノ)

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H).

20

奥施例4 (1132)

3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (3´ーフェニルプロピル) アミノ)

アロバン酸

HPLC測定条件:A

25

HPLC保持時間: 3.91分;

HPLC保持時間:3.89分; 寒肺例4 (1131) MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)+ HPLC測定条件:A フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(3-フェニルプロピル) アミノ) HPLC保持時間:3.93分; HPLC测定条件:A 3 - (N - ((2 - (2 - ((3 - フルオロベンジルアミノ) カルボニル) レロスソ恩

実施例4 (1135)

2

HPLC保持時間:3.88分;

アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

MASS = -> (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H).

3ー(N-((2-(2-((2-チエニルメチルアミノ)カルボニル)フ

20 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

MASS=-9 (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)+.

25

実施例4 (1136)

412

4=

PCT/JP03/06678

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (3-フェニルプロピル) 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)+

夹施例4 (1137)

3- (N- ((2- (2- ((2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

5 ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

HPLC运汽条件:A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)⁺

5

寒脑例4 (1138)

3- (N- ((2-(2-((1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)

フェニル) カルボニル) ーNー (ベンジル) アミノ) プロバン酸

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.86分;

20

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 519 (M+H)+,

3- (N- ((2-(2-((ビリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (ベンジル) アミノ) プロバ

25

PCT/JP03/06678

HPLC保持時間: 3.18分; HPLC測定条件:A

MASSF-9 (ESI, Pos., 20V): 987 (2M+H)+, 494 (M+H)+.

実施例4 (1140)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパ 3- (N- ((2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

HPLC測定条件:A

10 HPLC保持時間:3.12分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 987 (2M+H)+, 494 (M+H)+

3- (N- ((2- (2- ((1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン

ー2ーイル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ベン

ジッ) アミノ) ノロパン酸

2

HPI.C測定条件:A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 519 (M+H)+。

20

寒肺例4 (1142)

3- (N- ((2-(2-((ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ

ェニル) カルボニル) ーNー (ベンジル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

25 HPLC保持時間:3.77分;

MASS $\vec{\tau}$ - β (ESI, Pos., 20V) : 985 (2M+H)⁺, 493 (M+H)⁺.

実施例4 (1143)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間:3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)⁺。

契施例4(1144)

5 フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2- (2- ((3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)⁺。

2

実施例4 (1145)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ベンジル) アミノ) プロパン酸 3- (N- ((2-(2-((4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC測定条件:A

20 HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)+.

夷施例4 (1146)

3- (N- ((2- (2- ((4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロバン酸

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)⁺.

<u> 実施例4 (1147)</u>

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパ 3- (N- ((2- (2- ((N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

HPLC測定条件:A

HPLC保持時間: 3.78分;

5 MASSF-9 (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)+, 493.

寒施例4 (1148)

フェニル) フェニル) カルボニル) ーNー (ベンジル) アミノ) プロバン樹 3- (N- ((2-(2-((2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

15 HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 511 (M+H)+,

寒施例4 (1149)

20 HPLC测定条件:A フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロバン酸 3- (N- ((2- (2- ((3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 511 (M+H)+

25

実施例4 (1150)

PCT/JP03/06678

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ベンジル)アミノ)プロバン酸

FIPLC测定条件:A

実施例4 (1151)

(N- ((2-(2-((アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

HPLC遊炕祭年:A

5

HPLC保持時間: 3.58分;

MASS= -9 (ESI, Pos., 20V) : 907 (2M + Na) $^+$, 443 (M + H) $^+$.

5 3- (N- ((2-(2-((2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) ブロ

HPLC测定条件:A

HPLC保持時間: 3.73分

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)⁺,

実施例4 (1153)

ェニル) フェニル) カルボニル) -N-(ベンジル)アミノ)プロバン酸 3- (N- ((2-(2-((2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

HPLC测定条件:A

25

HPLC保持時間: 3.73分;

3- (N- ((2- (2- ((4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

HPLC保持時間:3.77分;

MASS = (ESI, Pos., 20V) : 511 (M+H).

S

 $MASS\vec{\tau}-b$ (ESI, Pos., 20V) : 997 (2M+H)⁺, 499 (M+H)⁺.

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) ーN- (ベンジル) アミノ) ブロ 3- (N- ((2-(2-((3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

よ) 環

ニノ) カアボニア) ーN-(ベンジル)アミノ)プロバン殴

5

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)⁺。

HPLC保持時間:3.86分; HPLC測定条件:A

[生物化学的实施例]

験等により証明された。 よって証明された。例えば、EDG-2に対する拮抗作用は、以下に示す実 本発明化合物が、LPA受容体に拮抗作用を有することは、以下の実験に

2 は測定感度の改良を加えたものである。以下に詳細な実験方法を示した。 下のように、本発明化合物を評価するために、測定精度の向上および/また 作製し、常法となっている方法を括用した。また、本発明の測定方法は、以 全体の操作は、基本的な遺伝子工学的手法に基づき、遺伝子高路現細胞を

細胞内カルシウムイオンの機度変化をモニターすることによるEDGー 2拮

20

Ham's F12 培地 (GIBCO BRL 社製、No.11765-047) を用いて培養した。まず、 括性評価を行なった。EDG-2発現細胞は、10%FBS(ウシ胎児血療)、 Fura2-AM(Dojindo 社製、No.348-05831)を細胞内へ取り込ませるため、細胞 ペニシリン/ストレプトャイシン、プラスチサイジン (5 n 8/m1) 会后 ヒトEDGー2遺伝子を過剰発現させたチャイニーズハムスターオーバリ (Chinese Hamster Ovary、CHO) 細胞を用いて眩受容体アンタゴニストの

を 5 μ M Fura2-AM 溶液 (10% FBS、20m M HEPES 緑価液 (p H7.4)、2.5m M プロベネシド (Sigma 社製、No.P-8761) 含有 Ham's F12 培地) で、37℃、60分間インキュベーションした。次に20m M HEPES 緑価液 (p H7.4)、2.5m M プロベネシドを含む Hanks 液で1回洗浄し、アッセイまで同 Hanks 液に浸した。蛍光ドラッグスクリーニングシステム(浜松ホトニクス社製、FDSS-2000)にプレートをセットし、30秒間無刺激で測定し、式(1)

Š

ス社製、FDSS-2000)にプレートをセットし、3 0 秒間無刺激で測定し、式(1)で示される本発明化合物の溶液を添加した。その5分後にLPA(絲濃度:100nM)を添加して、添加前後の細胞内カルシウムイオン濃度を3 秒間隔で測定した(励超波長3 4 0 n m および3 8 0 n m、蛍光波長5 0 0 n m)。式(1)で示される本発明化合物は、ジメチルスルホキシド(DMSO)に弦解し、総濃度が1 n M~1 0 μ Mになるように添加した。LPAとして、1 ーリノレノイル(18:3)ーLPAを使用した。1 ーリノレノイル(18:3)ーLPAを使用した。1 ーリノレノイル(18:3)ーリンホスファチジルコリン)(Sedary 社製)よりPLD(ホスホリバーゼ D)により合成した。EDGー2 拮抗活性は、式(1)で示される本発明化合物を含まないDMSOを添加したウェルでのLPA(終濃度:100nM)によるピーク値をコントロール値(A)とし、化合物で処理した細胞でのLPA

5

2

母 (%) を算出した。

添加前の値から添加後の値の훤(B)とを比較し、以下の数式を用いて抑制

| 漫 | |
|----------------|----------------------------|
| 実施例番号 | IC ₅₀ (μ mol/L) |
| 実施例3 | 0.41 |
| 夷施例3(1) | 0.78 |

製剤例1

以下の各成分を常法により混合した後打綻して、一錠中に50mgの活性成分を含有する錠剤100錠を得た。

製剤例2

以下の各成分を常法により混合した後、容液を常法により蔵菌し、5mLずつアンプルに充填し、常法により凍結乾燥し、1アンプル中20mgの活

15 性成分を含有するアンプル100本を得た。

・3- (N-((2-(2-((4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2,5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロバン酸 20g

9

.....1000m L

20 · 蒸留水

PCT/JP03/06678

₩ 9 稳 噩

퍫

1. 一般式(1)

HO
$$(R^1)$$
 (R^3) $($

[式中、AIt、

(1)C1~6アルキレン基、(2)C2~6アルケニレン基、または(3)C2~6ア て置換されてもよい。)、 ルキニレン語を扱わし(ただし、Aは1~3個のC1~4アルキル基によっ

Cyc1)は、(1)C3~15の炭森環、または(2)1~4個の窒果原子、1~2

5 個の酸茶原子および/または1~2個の硫黄原子を含む3~15員の複素環 を扱わし、

(1)C1~4アルキル基、(2)ハロゲン原子、(3)シアノ基、(4)トリハロメチル基、 (5)-OR⁴甚、(6)-SR⁷甚、(7)-NR⁸R⁹甚、(8)ニトロ甚、(9)-COOR¹⁰ 뵰、(10)−CONR"R"錯、(11)−NR"3COR"揺、(12)−SO2NR"R" 甚、(13)−NR¹⁷SO₂R¹⁸甚、(14)−S(O)R¹⁸甚、または(15)−SO₂R²⁰

2

R¹⁹およびR²⁰は、それぞれ独立して、

VO 03/099765

PCT/JP03/06678

(1)水繋原子、または(2)C 1~4アルキル甚を**衷わし、**

RªおよびR³は、それぞれ独立して、

(1)C1~4アルキル菇、(2)C1~4アルコキシ菇、または(3)ハロゲン原子を

R*およびR*は、それぞれ独立して

(1)水素原子、(2)C 1~4アルキル茁、(3)C 2~4アルケニル茁、(4)C 2~4 アルキニル甚、(5)ーOR⁸¹基によって置換されたC1~4アルキル基、(6)ー NR²²R²³基によって僻換されたC1~4アルキル基、または

を要わすか、

5 R4とR⁶はそれらが結合する窒素原子と一緒になって、3~15 異の単環、二 てもよい。)を表わし、 含有し、-OR³³基によって置換されたC1~4アルキル基によって置換され 環式または三環式複器環(ただし、該複器環は少なくとも一つの盤器原子を

R²¹、R²²、R²²およびR²⁸は、それぞれ独立して、

ᅜ (1)水菜原子、(2)C 1~4アルキル基、(3)C 2~6 アシル基、または(4)トリハ ロアセチル基を扱わし、

(I)単結合、(2)C 1 ~ 6 アルキレン基、(3)C 2 ~ 6 アルケニレン基、または(4) C2~6アルキニレン語を扱わし(ただし、Eは(I)C1~4アルキル茲およ

20 び(2)-OR20から遊択される1~3個の甚によって置換されたC1~4アル Rººは、(1)水森原子、(2)C1~4アルキル甚、(3)C2~6アシル甚、または キル基によって置換されてもよい。)、

(4)トリハロアセチル甚を表わし、

2個の砂紫原子および/または1~2個の硫黄原子を含む3~15員の複聚 Cyc2 は、(I)C 3~1 5の炭紫原、または(2)1~4 個の窒素原子、1~

概を扱わし、

(I)C 1~4アルキル甚、(2)ハロゲン原子、(3)シアノ基、(4)トリハロメチル甚、 R24Ht, 3)茁、(10)—CONR33R33茁、(11)—NR34COR35茁、(12)—SO2NR85R3 (5)-OR²⁷甚、(6)-SR²⁸基、(7)-NR²⁸R³⁰基、(8)=トロ基、(9)-COOR 甚を扱わし、 7班、(13)—NR36SO2R36班、(14)—S (0) R46班、または(15)—SO2R41

5 R27, R22, R29, R30, R31, R32, R33, R34, R35, R36, R37, R36, R39, R⁴⁰およびR⁴¹は、それぞれ独立して、

(I)水霖原子、または(2)C 1~4アルキル基を衰わし、

iは、0または1~5の整数を安わし、

mlt、Oまたは1~4の駐数を扱わし、

nは、0または1~4の駐敷を扱わし

7

mが2以上を扱わすとき、複数のR²は各々同じでも異なってもよく、nが2 ただし、iが2以上を扱わすとき、複数のR'は各々同じでも異なってもよく、 pは、0または1~5の整数を表わす。 以上を扱わすとき、複数のR9は各々同じでも異なってもよく、pが2以上を

20 衷わすとき、複数のR²⁴は各々同じでも異なってもよい。] て示される8-アラニン誘導体、それらのプロドラッグまたはそれらの塩。

2. 一般式 (IA)

(A)

請求の範囲1の記載と同じ意味を要わす。)で示される請求の範囲1記載の アミノ基によって置換されたC1~8アルキル基を衷わし、その他の記号は プロドラッグ。 (式中、R44は、(I)C 1~8 アルキル基、または(2) 1~2個の水酸菇または

3. 一般式 (IB)

(IB)

5 ルキル甚、または(3)1〜2個の水酸基またはアミノ甚によって置換されたCを要わす。)で示される請求の範囲 1 記載のプロドラッグ。 $1\!\sim\!8$ アルキル基を扱わし、その他の記号は뻵求の範囲1の記録と同じ意味 (式中、R⁴³およびR⁴⁴は、それぞれ独立して、(I)水紫原子、(2)C 1 ~8 ア

4. 一般式 (IC)

424

HO (R²)_m (R²)_m (IC)

(式中、すべての記号は請求の範囲1の記載と同じ意味を扱わす。) で示される請求の範囲1記載のプロドラッグ。

- 5 5. 額求の範囲 1 記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩を含有する医類組成物。
- 6. LPA受容体拮抗剤である期水の範囲 5 記載の医薬組成物。
- 10 7. LPA受容体がEDG-2受容体である請求の範囲6記載の医薬組成物。
- 8. 泌尿器系疾患の予防および/または治療剤である請求の範囲7記載の医薬組成物。
- 15 9. 茲関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳 関連疾患の予防および/または治療剤である請求の範囲7記載の医薬組成物。
- 10. 閉状の範囲1記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩の有効型を哺乳動物に投与することを特徴とする哺乳動物におけるEDGー
- 2に超因する疾患の予防および/または治療方法。

20

11. EDG-2に超因する疾患が、泌尿器系疾患である精水の範囲10記 歳の予防および/または治療方法。

- 5 12. EDG-2に起因する疾患が、癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳関連疾患である請求の範囲10記彙の予防および/または治療方法。
- 13. EDG-2に起因する疾患の予防または治療剤を製造するための開求 の範囲1記彙の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩の使用。
- 14. EDG-2に起因する疾患が、泌尿器系疾患である請求の範囲13記載の使用。
- 15 15. EDG-2に起因する疾患が、癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳関連疾患である請求の範囲13記録の使用。

| | Fucsimile No. | |
|---|--|------------|
| | Name and mailing address of the ISAY Authorized officer Japanese Patent Office | 7 |
| arch report 3 (02.09.03) | | 머 |
| ne claimed invention cannol be the claimed invention cannol be step when the document is card documents, such soon skilled in the art at family | meat which may throw doubts on priority staint(s) or which is to establish the publication date of mother citation or other ial reason (as specified in the property of the control of the | 4 6 4 |
| the application but cited to aderlying the invention a claimed invention cannot be dered to involve an inventive | አ - | # 3·1 |
| semational filing date or | continuation of Box C. | П |
| | P,A WO 02/092068 Al (Ono Pharmaceutical Co., AEG.), 21 November, 2002 (21.11.02), (Family: none) | |
| 1-9,13-16 | | |
| 1-9, 13-16 | A WO 01/71022 A2 (THE UNIVERSITY OF TENNESSEE RESEARCH CORP.), 27 September, 2001 (27.09.01), 6 AU 200149263 A | |
| 1-9, 13-16 | £ 23 € | |
| Relevant to claim No. | ₹ I | ξ į |
| | DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | <u>: </u> |
| ch ioms used) | Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CA (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN) | Elec |
| n the fields searched | Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched | Dog |
| 1/80, | D. FIELDS SEARCHED Ninhnum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl' C07C331/00-409/44, C07D201/00-521/00, A61K31/00-31/80, A61P1/00-43/00 | Min. |
| 307/52, 197, 137, | A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl ⁷ C07C233/83, 311/46, C07D209/16, 213/40, 217/06, 307 333/20, 401/12, 405/12, 409/12, 471/04, A61K31/197, A61K31/22, 31/222, 31/341, 31/381, 31/4045, 31/437, According to International Patent Classification (IPC) or to both mational classification and IPC | λαςο λ |
| ECT/JP03/06678 | INTERNATIONAL SEARCH REPORT International application No. PCT/JP03/06 | |

Fucsimite No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1998)

| | | <u> </u> | <u> </u> | T) Bo | μ | 1. [X] Classification and Auttornation 2. [7] | Box I | |
|-------------------|--|--|----------|--|--|---|--|--|
| Remark on Protest | No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.: | Cauris. Of any additional fee. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite paymen of any additional fee. As only some of the sequired additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report cove only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.: | | Bor II Observations were unity of international application, as follows: This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows: | Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the accound and third senicuces of Rule 6.4(a). | because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely: because they relate to subject matter which this International Searching and thus relate to a subject matter which this International Searching the provisions of Article 17(2)(a)(1) of Authority is not required, under the provisions of Article 17(2)(a)(1) of the PCT and Rule 39.1(iv) of the Regulations under the PCT, to search. Claims Nos: Decause they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an because they relate to parts of the international search can be carried out, specifically: | Box 1 Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet) This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons: | INTERNATIONAL SEARCH REPORT International application No. PCT/JP03/06678 |

Form PCT/ISA/210 (continuation of first sheet (1)) (July 1998)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP03/06678

| CORLINARIONAL Patent CLASSIFICATION NOT SUBJECT HATTER (International Patent CLASSIFICATION (PC)) Int.Cl ² 31/4402, 31/4406, 31/4409, 31/443, 31/4436, 31/4439, 31/4444, A61K11/472, 31/4725, A6181/46, 31/0, 31/0, 31/0, 13/02, 13/02, 13/08, 13/10, 35/00, 35/02, 35/04, 37/00, 43/00 (According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC) |
|--|
|--|

国際關查報告

国際出類番号 PCT/JP03/06678

| 国際調査機関の名称及びあて先 月本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区役が関三丁目4番3号 | 四級調査を売了した日 18.08.03 | * 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」国際出題目前の出題または特許であるが、国際出題目以底に公案されたもの 「L」優先相主張に乗該を提起する文献又は他の文献の発行目指しては他の特別な理由を確立するために引用する 女献 (理由を付す) 「O」日頭による間示、使用、展示特に首及する文献 「P」国際出題目前で、かつ優先権の主張の基礎となる出面 | □ C細の説きにも文献が列挙されている。 | P, A 〒0 02/092068 A1(小野薬品工業株式会社) (ファミリーなし) | P,A JP 2002-212070 A(小野聚品工業株式会社) 2002.07.31 (ファミリーなし) | A WO 01/71022 A2(THE UNIVERSITY OF TENNESSEE RESEARCH CORPORATION) 2001.09.27 &AU 200149263 A | カテゴリー* 3月用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の数示 NO 01/60819 A1(試験支酒株式会社) 2001.08.23 &AU 200132340 A | C. 関連すると認められる文献 引用文献の | 国別調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用額) CA (STN) , CAOLD (STN) , REGISTRY (STN) | 最小限資料以外の資料で関連を行った分野に含まれるもの | 開発を行った扱小班日報 (場所報用プロ (* 1 F C / /) Int. Cl. ' C07C231/00-409/44, C07D201/00-B21/00, A61K31/00-31/80, A61F1/00-43/00 | B. 関数を行った分野 | A. 発明の原する分野の分類(国際特許分類(I P C)) Int. Cl.' CO7C233/83, 311/46, CO7D209/16, 213/40, 217/06, 307/52, 333/20, 401/12, 405/12, 409/12, 471/04, A61K31/197, A61K31/22, 31/222, 31/341, 31/381, 31/405, 31/407, 31/4405, 31/4409, 31/443, 31/443, 31/4439, 31/444, A61K31/472, 31/4725, A61P1/16, 3/10, 5/14, 9/02, 9/10, 9/14, 11/00, 13/00, 13/02, 13/08, 13/10, 13/12, 17/06, 19/10, | 1 |
|---|---------------------|--|-----------------------|--|---|---|---|--------------------------|---|----------------------------|---|-------------|---|---|
| 柳斯庁等査官 (施限のある職員) 4H 954 | 回路関連和告の指送日 02.09.03 | の日の後に公装された文献 「国際出版日又は反先日後に公装された文献であって 出版と矛盾するものではなく、毎界の原理又は理論 の理解のために引用するもの 「X」特に関連のある文献であって、当版文献のみで毎明 「X」特に関連のある文献であって、当版文献と他の1以 上の文献との、当業者にとって自列である組合せに よって過歩性がないと考えられるもの 「&」同一パテントファミリー文献 | □ パテントファミリーに関する別紙を参照。 | 注社)2002.11.21 1−9,13−16 | 会社) 2002.07.31 1-9,13-16 | TENNESSEE RESEARCH 1-9, 13-16 9263 A | きは、その関連する箇所の数所 開来の範囲の哲学 2001. 08. 23 &AU 200132340 A 1-9, 13-16 | | 四弦に使用した用語) | | 31/80, A61P1/00-43/00 | | /52, 333/20, 401/12, 405/12, 409/12, 471/04, A61K31/197, //4406, 31/4409, 31/443, 31/4436, 31/4439, 31/444, /00, 13/00, 13/02, 13/08, 13/10, 13/12, 17/06, 19/10, | |

Form PCT/ISA/210 (extra sheet) (July 1998)

第2ページA. 栩の恕き A61P25/00, 25/02, 25/16, 25/28, 27/02, 27/06, 29/00, 35/00, 35/02, 35/04, 37/00, 43/00

国際關連報告

国際出版番号 PCT/JP03/06678

| 追加爾茲手数料の異語の申立てに関する注意 □ 追加爾茲手数料の異語の申立てに関する注意 □ 追加爾茲手数料の掛付と共に出版人から異語中立てがなかった。 □ 追加爾茲手数料の掛付と共に出版人から異語申立てがなかった。 | 4. 出題人が必要な追加調査手数料を期間内に持付しなかったので、この目されている要明に係る次の情求の範囲について作成した。 | 1. 出題人が必要な追加資金主要料をすべて利用内に用いていて、この原理について作成した。 2. 追加資金手費料を要求するまでもなく、すべての資金可能な損求の範囲につい加度変手数料の指付を求めなかった。 3. 目 出版人が必要な追加資金手数料を一部のみしか期間内に付付しなかったので、付のあった次の関求の範囲のみについて作成した。 | | 次に近べるようにこの国際出廊に二以上の発明があるとこの国際調査規模は移めた。 | 第1個 発明の単一性が欠加しているときの意見 (第1ページの3の続き) | 3. □ 数水の低田 は、徒興請求の低田であってPCTが 従って記憶されていない。 | 2. □ 税求の範囲 は、有徴総な国際関連をすることがでたい国際出節の部分に得るものである。つまり、 | 1. 図 指求の範囲 10-12 は、この国際調査規則が調査をすることを受しない対象に係るものである。つまり、 | 第1個 前来の範囲の一般の関連ができないときの意見(第1ページの2の終き) 法第8条第3項(PCT17条(2)(a))の規定により、この国別調査報告は次の理由により請求の範囲の一般しなかった。 |
|--|---|--|---------------------------------------|--|-------------------------------------|--|--|--|---|
| はかった。 | たので、この国際調査報告は、前来の私国の母初に記録。 | くの絵画について 口 並が | ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ | 調査機関は限めた。 |)の概念) | 徒風精求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に | 有徴絶な国際調査をすることができる程度まで所定の契件を徴たしていっまり、 | この国際調査規則が調査をすることを戻しない対象に係るものである。 自族による人体の処置方法に関するものであり、PCT第39.1(iv)の規定により、この国際調査機関が調査をするりである。 | ジの2の終き) 密和各は次の理由により請求の範囲の一部について作 |

模式PCT/1SA/210 (第1ページの模様 (1)) (1998年7月)

模式PCT/1SA/210(特別ページ)(1998年7月)